

(12)特許協力条約に基づいて公開された国際出願

(19) 世界知的所有権機関  
国際事務局



(43) 国際公開日  
2003 年 3 月 20 日 (20.03.2003)

PCT

(10) 国際公開番号  
WO 03/022850 A1

(51) 国際特許分類: C07D 487/04, A01N 43/90

(IKEGAMI, Hiroshi) [JP/JP]; 〒561-0802 大阪府 豊中市 曾根東町 2-1 0-4-4 2 0 Osaka (JP).

(21) 国際出願番号: PCT/JP02/08718

(22) 国際出願日: 2002 年 8 月 29 日 (29.08.2002)

(74) 代理人: 久保山 隆, 外(KUBOYAMA, Takashi et al.); 〒541-8550 大阪府 大阪市中央区 北浜四丁目 5 番 3 3 号 住友化学知的財産センター株式会社内 Osaka (JP).

(25) 国際出願の言語: 日本語

(26) 国際公開の言語: 日本語

(81) 指定国 (国内): US.

(30) 優先権データ:  
特願2001-266881 2001 年 9 月 4 日 (04.09.2001) JP

(84) 指定国 (広域): ヨーロッパ特許 (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE, SK, TR).

(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 住友化学工業株式会社 (SUMITOMO CHEMICAL COMPANY, LIMITED) [JP/JP]; 〒541-8550 大阪府 大阪市中央区 北浜四丁目 5 番 3 3 号 Osaka (JP).

添付公開書類:  
— 国際調査報告書

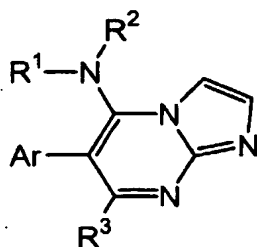
(72) 発明者; および

(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 池上 宏

2 文字コード及び他の略語については、定期発行される各 PCT ガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語のガイダンスノート」を参照。

(54) Title: IMIDAZO[1,2-a]PYRIMIDINES AND FUNGICIDE COMPOSITIONS CONTAINING THE SAME

(54) 発明の名称: イミダゾ [1, 2-a] ピリミジン及びこれを含有する殺菌剤組成物



(I)

(57) Abstract: Imidazo[1,2-a]pyrimidines represented by the general formula (I) have excellent control activity against plant diseases: (I) wherein R<sup>1</sup> and R<sup>2</sup> are each C1-C6 alkyl which may be substituted with one or more members selected from the group consisting of C1-C4 alkoxy, C2-C8 dialkylamino, C1-C4 alkylthio, C2-C5 alkoxy carbonyl, cyano and halogen, or the like, or R<sup>1</sup> and R<sup>2</sup> together with the nitrogen atom to which they are bonded may form a group derived from a 3- to 8-membered heterocycle; R<sup>3</sup> is halogeno or C1-C4 alkyl; and Ar is phenyl which may be substituted with a halogen atom or the like.

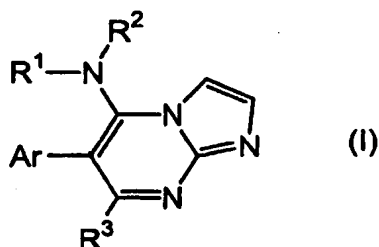
[続葉有]

WO 03/022850 A1



(57) 要約:

下式 [I]



(式中、R<sup>1</sup> および R<sup>2</sup> は C 1 - C 4 アルコキシ基、C 2 - C 8 ジアルキルアミノ基、C 1 - C 4 アルキルチオ基、C 2 - C 5 アルコキシカルボニル基、シアノ基およびハロゲン原子からなる群より選ばれる 1 種以上で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキル基等を表すか、あるいは、R<sup>1</sup> および R<sup>2</sup> が、R<sup>1</sup> と R<sup>2</sup> とが結合している窒素原子と一緒にあって、3 - 8 員環の複素環基を表し、R<sup>3</sup> はハロゲン原子または C 1 - C 4 アルキル基を表し、Ar はハロゲン原子等で置換されていてもよいフェニル基を表す。)

で示されるイミダゾ [1, 2 - a] ピリミジン は、植物病害に対する優れた防除活性を有する。

## 明 細 書

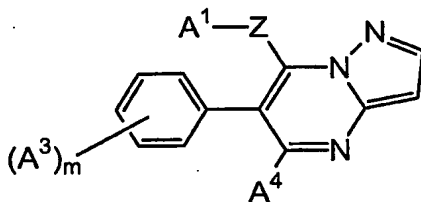
イミダゾ [1, 2-a] ピリミジン及びこれを含有する殺菌剤組成物

## 技術分野

- 5 本発明は、イミダゾ [1, 2-a] ピリミジン及びこれを含有する殺菌剤組成物に関する。

## 背景技術

- 日本公開特許公報の特開 2001-19693 号には、下式にて示されるフェ  
10 ニル基が置換したピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン



- [式中、ZはO、S、NA<sup>2</sup>または単結合を表し、A<sup>1</sup>は場合によっては置換されるアルキル、アルケニル、アルキニル、アルカジエニル、ハロアルキル、アリー  
ル、ヘテロアリール、シクロアルキル、ビスシクロアルキルまたは複素環式基を表  
15 し、A<sup>2</sup>は水素原子か、または場合によって置換されるアルキル、アルケニル、ア  
ルキニル、アルカジエニル、ハロアルキル、アリール、ヘテロアリール、シクロ  
アルキル、ビスシクロアルキル若しくは複素環式基を表し、mは0若しくは整数1  
～4であり、A<sup>3</sup>は各々独立して、ハロゲン原子、アルキル、アルコキシまたはニ  
トロ基を表し、A<sup>4</sup>はハロゲン原子を表す。]

- 20 が開示されている。該化合物は広範囲の真菌類に対する優れた殺菌・殺カビ活性  
を有すると記載されている。

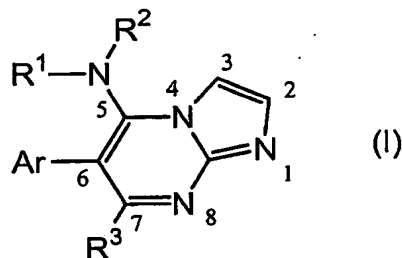
- また、ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジンの異性体であるイミダゾ [1, 2-a]  
a] ピリミジンについては、除草活性または抗菌活性を有するある種のイミダゾ  
[1, 2-a] ピリミジンが開示されている [Acta Nat. de l'Ateneo Parmense,  
25 18 (1982) 93、J. Med. Chem. (1975) 8, 1253 等] が、6 位に置換基を有するイ  
ミダゾ [1, 2-a] ピリミジンは開示されていない。

本発明は、植物病害に対する優れた防除活性を有する新規なイミダゾ〔1，2－a〕ピリミジンを提供することにある。

### 発明の開示

- 5 本発明者は、鋭意検討した結果、式〔I〕で示される6－フェニルイミダゾ〔1，2－a〕ピリミジンが優れた植物病害防除効果を有することを見出し、本発明に至った。

即ち、本発明は、下式

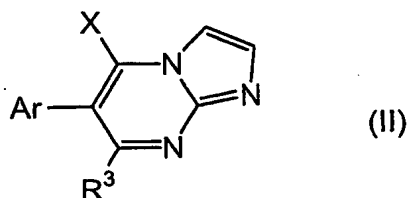


- 10 [式中、R<sup>1</sup> は水素原子；C 1－C 4アルコキシ基、C 2－C 8ジアルキルアミノ基、C 1－C 4アルキルチオ基、C 2－C 5アルコキシカルボニル基、シアノ基およびハロゲン原子からなる群より選ばれる1種以上で置換されていてもよいC 1－C 6アルキル基；ハロゲン原子で置換されていてもよいC 3－C 6アルケニル基；ハロゲン原子で置換されていてもよいC 3－C 6アルキニル基；C 1－C 4アルキル基およびハロゲン原子からなる群より選ばれる1種以上で置換されていてもよいC 3－C 8シクロアルキル基；C 1－C 4アルキル基、C 1－C 4アルコキシ基、C 1－C 4アルキルチオ基、C 1－C 3ハロアルキル基、C 1－C 3ハロアルコキシ基、ハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基およびC 2－C 5アルコキシカルボニル基からなる群より選ばれる1種以上でベンゼン環上にて置換されていてもよいフェニル基あるいはフェニルC 1－C 2アルキル基；またはC 1－C 4アルキル基、C 1－C 4アルコキシ基、C 1－C 4アルキルチオ基、C 1－C 3ハロアルキル基、ハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基およびC 2－C 5アルコキシカルボニル基からなる群より選ばれる1種以上で置換されていてもよい5－6員環の複素環基を表し、
- 20 R<sup>2</sup> は水素原子；C 1－C 4アルコキシ基、C 2－C 8ジアルキルアミノ基、C
- 25

- 1-C4アルキルチオ基、C2-C5アルコキシカルボニル基、シアノ基およびハロゲン原子からなる群より選ばれる1種以上で置換されていてもよいC1-C6アルキル基；ハロゲン原子で置換されていてもよいC3-C6アルケニル基；ハロゲン原子で置換されていてもよいC3-C6アルキニル基；C1-C4アルキル基およびハロゲン原子からなる群より選ばれる1種以上で置換されていてもよいC3-C8シクロアルキル基；C1-C4アルキル基、C1-C4アルコキシ基、C1-C4アルキルチオ基、C1-C3ハロアルキル基、C1-C3ハロアルコキシ基、ハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基およびC2-C5アルコキシカルボニル基からなる群より選ばれる1種以上でベンゼン環上にて置換されていてもよいフェニル基あるいはフェニルC1-C2アルキル基；C1-C4アルキル基、C1-C4アルコキシ基、C1-C4アルキルチオ基、C1-C3ハロアルキル基、ハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基およびC2-C5アルコキシカルボニル基からなる群より選ばれる1種以上で置換されていてもよい5-6員環の複素環基；C1-C6アルキル基、フェニル基およびベンジル基（該フェニル基およびベンジル基は、C1-C4アルキル基、C1-C3ハロアルキル基およびハロゲン原子からなる群より選ばれる1種以上でベンゼン環上にて置換されていてもよい。）からなる群より選ばれる1種または2種で置換されていてもよいアミノ基；C1-C4アルコキシ基；フェノキシ基；ベンジルオキシ基を表すか、あるいは、 $R^1$  および  $R^2$  は、 $R^1$  と  $R^2$  とが結合している窒素原子と一緒になつて、3-8員環の複素環基（該複素環基は、C1-C4アルキレン基またはC2-C4アルケニレン基で置換されて多環系複素環基を表していてもよく、C1-C4アルキル基、C1-C4アルコキシ基、C1-C4アルキルチオ基、C1-C3ハロアルキル基、C1-C4アシル基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、ニトロ基、シアノ基およびC2-C5アルコキシカルボニル基からなる群より選ばれる1種以上で置換されていてもよい。）を表し、 $R^3$  はハロゲン原子またはC1-C4アルキル基を表し、Arはハロゲン原子、C1-C4アルキル基、C1-C4アルコキシ基またはC1-C3ハロアルキル基から選ばれる群より選ばれる1種以上で置換されていてもよいフェニル基を表す。]

で示されるイミダゾ[1, 2-a]ピリミジン[I] (以下、本発明化合物と記す。)、それを有効成分として含有する殺菌剤組成物、およびそれらを植物に施用することを特徴とする植物病害防除方法を提供する。

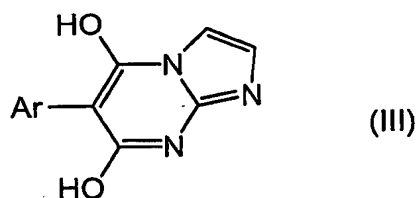
本発明はさらに、本発明化合物の製造中間体として有用な下式



5

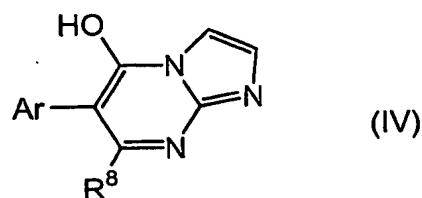
[式中、Xはハロゲン原子を表し、ArおよびR<sup>3</sup>は前記と同じ意味を表す。]

で示されるイミダゾ[1, 2-a]ピリミジン[II]、下式



[式中、Arは前記と同じ意味を表す。]

10 で示されるイミダゾ[1, 2-a]ピリミジン[III]および下式



[式中、R<sup>8</sup>はC1-C4アルキル基を表し、Arは前記と同じ意味を表す。]

で示されるイミダゾ[1, 2-a]ピリミジン[IV]をも提供する。

15 本発明において、R<sup>1</sup> またはR<sup>2</sup> で示される

C1-C4アルコキシ基、C2-C8ジアルキルアミノ基、C1-C4アルキルチオ基、C2-C5アルコキシカルボニル基、シアノ基およびハロゲン原子からなる群より選ばれる1種以上で置換されていてもよいC1-C6アルキル基としては、例えば、メチル基、エチル基、プロピル基、ブチル基、ペンチル基、ヘキ

20 シル基、イソプロピル基、sec-ブチル基、イソブチル基、t-ブチル基、1

- ーメチルブチル基、1-エチルプロピル基、2-メチルブチル基、3-メチルブチル基、1, 2-ジメチルプロピル基、1, 1-ジメチルプロピル基、1, 3-ジメチルブチル基、3, 3-ジメチルブチル基、2, 2-ジメチルプロピル基、2-メトキシエチル基、3-メトキシプロピル基、2-エトキシエチル基、3-エトキシプロピル基、3-ブトキシプロピル基、3-イソプロポキシプロピル基、2, 2-ジメトキシエチル基、2, 2-ジエトキシエチル基、2-(ジメチルアミノ)エチル基、2-(ジエチルアミノ)エチル基、2-(ジプロピルアミノ)エチル基、2-(ジブチルアミノ)エチル基、3-(ジメチルアミノ)プロピル基、3-(ジエチルアミノ)プロピル基、3-(ジプロピルアミノ)プロピル基、3-(ジブチルアミノ)プロピル基、2-(メチルチオ)エチル基、2-(エチルチオ)エチル基、メトキシカルボニルメチル基、エトキシカルボニルメチル基、t-ブトキシカルボニルメチル基、1-(メトキシカルボニル)エチル基、1-(エトキシカルボニル)エチル基、2-(エトキシカルボニル)エチル基、1-(メトキシカルボニル)-2-メチル-1-プロピル基、ジ(エトキシカルボニル)メチル基、シアノメチル基、2-シアノエチル基、2-フルオロエチル基、2, 2, 2-トリフルオロエチル基、2-クロロエチル基、2-ブロモエチル基、3-クロロプロピル基、3-ブロモプロピル基、2, 5-ジクロロペンチル基、1-メチル-2, 2, 2-トリフルオロエチル基が挙げられ、
- ハロゲン原子で置換されていてもよいC3-C6アルケニル基としては、例えば、2-プロペニル基、2-メチル-2-プロペニル基、2-クロロ-2-プロペニル基、3-クロロ-2-プロペニル基、3, 3-ジクロロ-2-プロペニル基が挙げられ、
- ハロゲン原子で置換されていてもよいC3-C6アルキニル基としては、例えば、2-プロピニル基、3-クロロ-2-プロピニル基が挙げられ、
- C1-C4アルキル基およびハロゲン原子からなる群より選ばれる1種以上で置換されていてもよいC3-C8シクロアルキル基としては、例えば、シクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、2-メチルシクロヘキシル基、3-メチルシクロヘキシル基、4-メチルシクロヘキシル基、2, 3-ジメチルシクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロオクチル基、4

- ークロシクロヘキシル基が挙げられ、  
C1-C4アルキル基、C1-C4アルコキシ基、C1-C4アルキルチオ基、  
C1-C3ハロアルキル基、C1-C3ハロアルコキシ基、ハロゲン原子、ニト  
5 る1種以上でベンゼン環上にて置換されていてもよいフェニル基としては、無置  
換のフェニル基のほかに、例えば、メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロ  
ピル基、*t*-ブチル基、メトキシ基、エトキシ基、プロポキシ基、ブトキシ基、  
*sec*-ブトキシ基、メチルチオ基、トリフルオロメチル基、トリフルオロメト  
キシ基、1, 1, 2, 2-テトラフルオロエトキシ基、フッ素原子、塩素原子、  
10 臭素原子、ヨウ素原子、ニトロ基、シアノ基、メトキシカルボニル基、エトキシ  
カルボニル基、プロピルオキシカルボニル基、ブチルオキシカルボニル基等の置  
換基で置換されたフェニル基が挙げられ、  
C1-C4アルキル基、C1-C4アルコキシ基、C1-C4アルキルチオ基、  
C1-C3ハロアルキル基、C1-C3ハロアルコキシ基、ハロゲン原子、ニト  
15 ロ基、シアノ基およびC2-C5アルコキシカルボニル基からなる群より選ばれ  
る1種以上でベンゼン環上にて置換されていてもよいフェニルC1-C2アルキ  
ル基としては、無置換のベンジル基、1-フェニルエチル基、2-フェニルエチ  
ル基のほかに、例えば、メチル基、トリフルオロメチル基、フッ素原子、塩素原  
子、臭素原子、ヨウ素原子、メトキシ基、エトキシ基、トリフルオロメトキシ基、  
20 ニトロ基、エトキシカルボニル基、シアノ基等の置換基で置換されたベンジル基、  
1-フェニルエチル基、2-フェニルエチル基が挙げられ、  
C1-C4アルキル基、C1-C4アルコキシ基、C1-C4アルキルチオ基、  
C1-C3ハロアルキル基、ハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基およびC2-C  
5 アルコキシカルボニル基からなる群より選ばれる1種以上で置換されていても  
25 よい5-6員環の複素環基における複素環基としては、例えば、ピロリジン-1  
-イル基、ピペリジン-1-イル基、ピペリジン-3-イル基、モルホリン-4  
-イル基、ピペラジン-1-イル基、2-チアゾリン-2-イル基、イソキサゾ  
ール-5-イル基、イソキサゾール-3-イル基、イソチアゾール-5-イル基、  
チアゾール-2-イル基、1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル基、ピリジン

- −2−イル基、ピリジン−3−イル基、ピリジン−4−イル基、ピリミジン−2−イル基、ピリミジン−4−イル基、ピリミジン−5−イル基、ピラジン−2−イル基、1, 2, 4−トリアジン−3−イル基が挙げられる。これらの複素環基はC1−C4アルキル基、C1−C4アルコキシ基、C1−C4アルキルチオ基、
- 5 C1−C3ハロアルキル基、ハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基およびC2−C5アルコキシカルボニル基からなる群より選ばれる1種以上で置換されていてもよく、該置換基としては、例えば、メチル基、エチル基、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、メトキシ基、ニトロ基、トリフルオロメチル基、メチルチオ基、エチルチオ基、ニトロ基、エトキシカルボニル基が挙げられる。

10

本発明において、 $R^2$  で示される

- C1−C6アルキル基、フェニル基およびベンジル基（該フェニル基およびベンジル基は、C1−C4アルキル基、C1−C3ハロアルキル基およびハロゲン原子からなる群より選ばれる1種以上でベンゼン環上にて置換されていてもよい。）
- 15 からなる群より選ばれる1種または2種で置換されていてもよいアミノ基としては、例えば、アミノ基、メチルアミノ基、ジメチルアミノ基、*t*−ブチルアミノ基、フェニルアミノ基、ジフェニルアミノ基、*N*−フェニル−*N*−メチルアミノ基、4−メチルフェニルアミノ基、4−クロロフェニルアミノ基、3−（トリフルオロメチル）フェニルアミノ基が挙げられ、
- 20 C1−C4アルコキシ基としては、例えば、メトキシ基、エトキシ基、*t*−ブトキシ基が挙げられる。

- 本発明において、 $R^1$  と  $R^2$  とが結合している窒素原子と一緒に、 $R^1$  および  $R^2$  で示される3−8員環の複素環基としては、アジリジン−1−イル基、アゼチジン−1−イル基、ピロリジン−1−イル基、3−ピロリン−1−イル基、
- 25 ピロール−1−イル基、ピペリジン−1−イル基、1, 2, 3, 6−テトラヒドロピリジン−1−イル基、ヘキサメチレンイミン−1−イル基、ヘプタメチレンイミン−1−イル基等のヘテロ原子として1つの窒素原子のみを有す3−8員環の複素環基、2−イミダゾリン−1−イル基、ピラゾール−1−イル基、イミダ

ゾールー1-イル基、1, 2, 3-トリアゾールー1-イル基、ピペラジーン-1-イル基、1, 4, 5, 6-テトラヒドロピリミジン-1-イル基、1, 2, 4-トリアゾールー1-イル基、テトラゾールー1-イル基等のヘテロ原子として2つ以上の窒素原子を有す3-8員環の複素環基、モルホリン-4-イル基、チアゾリジン-3-イル基、チオモルホリン-4-イル基等のヘテロ原子として1つの窒素原子と1つ以上の他のヘテロ原子を有す3-8員環の複素環基が挙げられる。また、該複素環基はC1-C4アルキレン基（メチレン基、エチレン基、トリメチレン基、テトラメチレン基）またはC2-C4アルケニレン基（ビニレン基、プロペニレン基、2-ブテニレン基、1, 3-ブタジエニレン基）で置換

5 10 15 20 25

されていてもよく、C1-C4アルキレン基またはC2-C4アルケニレン基が3-8員環の複素環基に置換することによって形成される多環系複素環基としては、例えば2-アザビシクロ[2. 2. 1]ヘプタン-2-イル基、7-アザビシクロ[2. 2. 1]ヘプタン-7-イル基、2-アザビシクロ[2. 2. 2]オクタン-2-イル基、3-アザビシクロ[3. 2. 1]オクタン-3-イル基、2-アザビシクロ[3. 2. 1]オクタン-2-イル基、6-アザビシクロ[3. 2. 1]オクタン-6-イル基、8-アザビシクロ[3. 2. 1]オクタン-8-イル基、3-アザビシクロ[3. 2. 2]ノナン-3-イル基、6-アザビシクロ[3. 2. 2]ノナン-6-イル基、2-アザビシクロ[3. 3. 0]オクタン-2-イル基、3-アザビシクロ[3. 3. 0]オクタン-3-イル基、2-アザビシクロ[4. 3. 0]ノナン-2-イル基、3-アザビシクロ[4. 3. 0]ノナン-3-イル基、7-アザビシクロ[4. 3. 0]ノナン-7-イル基、8-アザビシクロ[4. 3. 0]ノナン-8-イル基、2-アザビシクロ[4. 4. 0]デカン-2-イル基、3-アザビシクロ[4. 4. 0]デカン-3-イル基、インドリン-1-イル基、1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリン-1-イル基、1, 2, 3, 4-テトラヒドロイソキノリン-2-イル基、インドール-1-イル基、インダゾール-1-イル基、ベンズイミダゾール-1-イル基が挙げられる。更に、これらの複素環基はC1-C4アルキル基（例えば、メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基）、C1-C4アルコキシ基（例えば、メトキシ基）、C1-C4アルキルチオ基（例えば、メチルチオ基）、C1-C3

ハロアルキル基 (例えば、トリフルオロメチル基)、C 1－C 4 アシル基 (例えば、ホルミル基、アセチル基)、ハロゲン原子 (例えば、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子)、ヒドロキシ基、ニトロ基、シアノ基および C 2－C 5 アルコキシカルボニル基 (例えば、メトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、プロピルオキシカルボニル基、*t*-ブトキシカルボニル基) からなる群より選ばれる 1 種以上で置換されていてもよい。

本発明化合物において、 $R^1 R^2 N$  の好ましい態様としては、 $R^1$  および  $R^2$  が独立して、水素原子；C 1－C 4 アルコキシ基、C 2－C 8 ジアルキルアミノ基、C 1－C 4 アルキルチオ基、C 2－C 5 アルコキシカルボニル基、シアノ基およびハロゲン原子のうちの 1 種以上で置換されていてもよい C 1－C 6 アルキル基；ハロゲン原子で置換されていてもよい C 3－C 6 アルケニル基；ハロゲン原子で置換されていてもよい C 3－C 6 アルキニル基；または C 1－C 4 アルキル基およびハロゲン原子のうちの 1 種以上で置換されていてもよい C 3－C 8 シクロアルキル基であるか、あるいは、 $R^1$  および  $R^2$  が、 $R^1$  と  $R^2$  とが結合している窒素原子と一緒にあって、C 1－C 4 アルキレン基または C 2－C 4 アルケニレン基で置換されてもよく、C 1－C 4 アルキル基、C 1－C 4 アルコキシ基、C 1－C 4 アルキルチオ基、トリフルオロメチル基、C 1－C 4 アシル基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、ニトロ基、シアノ基および C 2－C 5 アルコキシカルボニル基からなる群より選ばれる 1 種以上で置換されていてもよい 3－8 員環の複素環式基が挙げられる。更に好ましい態様としては、 $R^1$  および  $R^2$  が独立して、ハロゲン原子で置換されていてもよい C 1－C 6 アルキル基；ハロゲン原子で置換されていてもよい C 3－C 6 アルケニル基；ハロゲン原子で置換されていてもよい C 3－C 6 アルキニル基；または C 1－C 4 アルキル基およびハロゲン原子のうちの 1 種以上で置換されていてもよい C 3－C 8 シクロアルキル基であるか、あるいは、 $R^1$  および  $R^2$  が、 $R^1$  と  $R^2$  とが結合している窒素原子と一緒にあって、C 1－C 4 アルキル基で置換されていてもよい、ピロリジン-1-イル基、3-ピロリン-1-イル基、ピペリジン-1-イル基、1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン-1-イル基、ヘキサメチレンイミン-1-イル基、ピペラジン

5 ハロゲン原子としては、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子が挙げられ、

本発明化合物において、 $R^3$  の好ましい態様としては、塩素原子またはメチル  
10 基が挙げられる。

本発明において、Arで示されるハロゲン原子、C1-C4アルキル基、C1-C4アルコキシ基またはC1-C3ハロアルキル基から選ばれる群より選ばれる1種以上で置換されていてもよいフェニル基としては、無置換のフェニル基のほかに、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子、メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、t-ブチル基、メトキシ基、エトキシ基、プロピルオキシ基、イソプロピルオキシ基、t-ブチルオキシ基、トリフルオロメチル基等の置換基で置換されたフェニル基が挙げられる。

本発明化合物において、Arの好ましい態様としては、その2位、4位および6位のうちの1箇所以上がハロゲン原子で置換されたフェニル基が挙げられ、更に好ましい態様としては、その2位、4位および6位のうちの少なくとも2箇所以上がフッ素原子または塩素原子で置換され、3位および5位が置換されていないフェニル基が挙げられる。具体的には、2-クロロフェニル基、2-フルオロフェニル基、2, 6-ジクロロフェニル基、2, 6-ジフルオロフェニル基、2, 4-ジクロロフェニル基、2, 4-ジフルオロフェニル基、2-クロロ-6-フルオロフェニル基、2, 4, 6-トリフルオロフェニル基、4-クロロ-2, 6-ジフルオロフェニル基、2-クロロ-4, 6-ジフルオロフェニル基、2, 6-ジクロロ-4-フルオロフェニル基、2, 4-ジクロロ-6-フルオロフェニ

ル基、2, 4, 6-トリクロロフェニル基が挙げられる。

本発明化合物においては、不斉炭素や二重結合を有する場合があるが、光学活性異性体 ((+) ー体、(−) ー体) または幾何異性体の夫々の全ての比率の混合物および一方の純品はすべて本発明の範囲に含まれる。また、本発明化合物の塩も、本発明の範囲に含まれる。

本発明化合物のうち、植物病害防除効果に優れた化合物の例として、5- (ピペリジン-1-イル) -6- (2, 4, 6-トリフルオロフェニル) -7-クロロイミダゾ [1, 2-a] ピリミジン、5- (4-メチルピペリジン-1-イル) -6- (2, 4, 6-トリフルオロフェニル) -7-クロロイミダゾ [1, 2-a] ピリミジン、5- (2-メチルピペリジン-1-イル) -6- (2, 4, 6-トリフルオロフェニル) -7-クロロイミダゾ [1, 2-a] ピリミジン、5- (モルホリン-4-イル) -6- (2, 4, 6-トリフルオロフェニル) -7-クロロイミダゾ [1, 2-a] ピリミジン、5- (チオモルホリン-4-イル) -6- (2, 4, 6-トリフルオロフェニル) -7-クロロイミダゾ [1, 2-a] ピリミジン、5- (ヘキサメチレンイミン-1-イル) -6- (2, 4, 6-トリフルオロフェニル) -7-クロロイミダゾ [1, 2-a] ピリミジン、5- (2, 5-ジメチルピロリジン-1-イル) -6- (2, 4, 6-トリフルオロフェニル) -7-クロロイミダゾ [1, 2-a] ピリミジン、5-ジプロピルアミノ-6- (2, 4, 6-トリフルオロフェニル) -7-クロロイミダゾ [1, 2-a] ピリミジン、5-ジアリルアミノ-6- (2, 4, 6-トリフルオロフェニル) -7-クロロイミダゾ [1, 2-a] ピリミジン、5- (ピペリジン-1-イル) -6- (2, 4, 6-トリフルオロフェニル) -7-メチルイミダゾ [1, 2-a] ピリミジン、5- (4-メチルピペリジン-1-イル) -6- (2, 4, 6-トリフルオロフェニル) -7-メチルイミダゾ [1, 2-a] ピリミジン、5- (2-メチルピペリジン-1-イル) -6- (2, 4, 6-トリフルオロフェニル) -7-メチルイミダゾ [1, 2-a] ピリミジン、5- (モルホリン-4-イル) -6- (2, 4, 6-トリフルオロフェニル) -7-メチルイミダゾ [1, 2-a] ピリミジン、5- (チオモルホリン-4-イル)

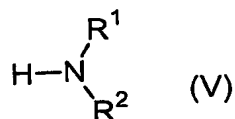
- 6—(2, 4, 6—トリフルオロフェニル)—7—メチルイミダゾ[1, 2—*a*]  
ピリミジン、5—(ヘキサメチレンイミン—1—イル)—6—(2, 4, 6—トリ  
フルオロフェニル)—7—メチルイミダゾ[1, 2—*a*]ピリミジン、5—(2,  
5—ジメチルピロリジン—1—イル)—6—(2, 4, 6—トリフルオロフェニ  
5 ル)—7—メチルイミダゾ[1, 2—*a*]ピリミジン、5—ジプロピルアミノ—6  
—(2, 4, 6—トリフルオロフェニル)—7—メチルイミダゾ[1, 2—*a*]ピ  
リミジン、5—ジアリルアミノ—6—(2, 4, 6—トリフルオロフェニル)—  
7—メチルイミダゾ[1, 2—*a*]ピリミジン、  
5—(ピペリジン—1—イル)—6—(2—クロロ—6—フルオロフェニル)—  
10 7—クロロイミダゾ[1, 2—*a*]ピリミジン、5—(4—メチルピペリジン—1  
—イル)—6—(2—クロロ—6—フルオロフェニル)—7—クロロイミダゾ[1,  
2—*a*]ピリミジン、5—(2—メチルピペリジン—1—イル)—6—(2—ク  
ロロ—6—フルオロフェニル)—7—クロロイミダゾ[1, 2—*a*]ピリミジン、  
5—(モルホリン—4—イル)—6—(2—クロロ—6—フルオロフェニル)—  
15 7—クロロイミダゾ[1, 2—*a*]ピリミジン、5—(チオモルホリン—4—イル)  
—6—(2—クロロ—6—フルオロフェニル)—7—クロロイミダゾ[1, 2—*a*]  
ピリミジン、5—(ヘキサメチレンイミン—1—イル)—6—(2—クロロ—6  
—フルオロフェニル)—7—クロロイミダゾ[1, 2—*a*]ピリミジン、5—(2,  
5—ジメチルピロリジン—1—イル)—6—(2—クロロ—6—フルオロフェニ  
20 ル)—7—クロロイミダゾ[1, 2—*a*]ピリミジン、5—ジプロピルアミノ—6  
—(2—クロロ—6—フルオロフェニル)—7—クロロイミダゾ[1, 2—*a*]ピ  
リミジン、5—ジアリルアミノ—6—(2—クロロ—6—フルオロフェニル)—  
7—クロロイミダゾ[1, 2—*a*]ピリミジン、  
5—(ピペリジン—1—イル)—6—(2—クロロ—6—フルオロフェニル)—  
25 7—メチルイミダゾ[1, 2—*a*]ピリミジン、5—(4—メチルピペリジン—1  
—イル)—6—(2—クロロ—6—フルオロフェニル)—7—メチルイミダゾ[1,  
2—*a*]ピリミジン、5—(2—メチルピペリジン—1—イル)—6—(2—ク  
ロロ—6—フルオロフェニル)—7—メチルイミダゾ[1, 2—*a*]ピリミジン、  
5—(モルホリン—4—イル)—6—(2—クロロ—6—フルオロフェニル)—

- 7-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリミジン、5-(チオモルホリン-4-イル)  
-6-(2-クロロ-6-フルオロフェニル)-7-メチルイミダゾ[1,2-a]  
ピリミジン、5-(ヘキサメチレンイミン-1-イル)-6-(2-クロロ-6-  
フルオロフェニル)-7-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリミジン、5-(2,  
5-ジメチルピロリジン-1-イル)-6-(2-クロロ-6-フルオロフェニル)  
-7-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリミジン、5-ジプロピルアミノ-6-  
(2-クロロ-6-フルオロフェニル)-7-メチルイミダゾ[1,2-a]ピ  
リミジン、5-ジアリルアミノ-6-(2-クロロ-6-フルオロフェニル)-  
7-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリミジン、  
10 5-(ピペリジン-1-イル)-6-(2,6-ジフルオロフェニル)-7-クロ  
ロイミダゾ[1,2-a]ピリミジン、5-(4-メチルピペリジン-1-イル)  
-6-(2,6-ジフルオロフェニル)-7-クロロイミダゾ[1,2-a]ピリ  
ミジン、5-(2-メチルピペリジン-1-イル)-6-(2,6-ジフルオロ  
フェニル)-7-クロロイミダゾ[1,2-a]ピリミジン、5-(モルホリン-  
15 4-イル)-6-(2,6-ジフルオロフェニル)-7-クロロイミダゾ[1,  
2-a]ピリミジン、5-(チオモルホリン-4-イル)-6-(2,6-ジフ  
ルオロフェニル)-7-クロロイミダゾ[1,2-a]ピリミジン、5-(ヘキサ  
メチレンイミン-1-イル)-6-(2,6-ジフルオロフェニル)-7-クロ  
ロイミダゾ[1,2-a]ピリミジン、5-(2,5-ジメチルピロリジン-1-  
20 イル)-6-(2,6-ジフルオロフェニル)-7-クロロイミダゾ[1,2-a]  
ピリミジン、5-ジプロピルアミノ-6-(2,6-ジフルオロフェニル)-7  
-クロロイミダゾ[1,2-a]ピリミジン、5-ジアリルアミノ-6-(2,6  
-ジフルオロフェニル)-7-クロロイミダゾ[1,2-a]ピリミジン、  
5-(ピペリジン-1-イル)-6-(2,6-ジフルオロフェニル)-7-メ  
25 チルイミダゾ[1,2-a]ピリミジン、5-(4-メチルピペリジン-1-イル)  
-6-(2,6-ジフルオロフェニル)-7-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリ  
ミジン、5-(2-メチルピペリジン-1-イル)-6-(2,6-ジフルオロ  
フェニル)-7-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリミジン、5-(モルホリン-  
4-イル)-6-(2,6-ジフルオロフェニル)-7-メチルイミダゾ[1,

2-a] ピリミジン、5-(チオモルホリン-4-イル)-6-(2, 6-ジフルオロフェニル)-7-メチルイミダゾ[1, 2-a] ピリミジン、5-(ヘキサメチレンイミン-1-イル)-6-(2, 6-ジフルオロフェニル)-7-メチルイミダゾ[1, 2-a] ピリミジン、5-(2, 5-ジメチルピロリジン-1-イル)-6-(2, 6-ジフルオロフェニル)-7-メチルイミダゾ[1, 2-a] ピリミジン、5-ジプロピルアミノ-6-(2, 6-ジフルオロフェニル)-7-メチルイミダゾ[1, 2-a] ピリミジン、5-ジアリルアミノ-6-(2, 6-ジフルオロフェニル)-7-メチルイミダゾ[1, 2-a] ピリミジンが挙げられる。

10

本発明化合物は、イミダゾ[1, 2-a] ピリミジン [I I] と、下式



[式中、R<sup>1</sup> および R<sup>2</sup> は前記と同じ意味を表す。]

で示されるアミン [V] とを反応させることにより製造することができる。イミダゾ[1, 2-a] ピリミジン [I I] 1モルに対して、アミン [V] は1モルが理論量であるが、反応の状況に応じて適宜変更することも可能である。

該反応は、無溶媒で行なうかまたは不活性溶媒中で行なう。用いることのできる不活性溶媒としては、ジオキサン、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、メチル t-ブチルエーテル等のエーテル類、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、1, 2-ジクロロエタン、クロロベンゼン等のハロゲン化炭化水素類、トルエン、ベンゼン、キシレン等の炭化水素類、N, N-ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド等の非プロトン性極性溶媒、メタノール、エタノール、イソプロピルアルコール等のアルコール類が挙げられる。

該反応は塩基の存在下に行なうことができる。イミダゾ[1, 2-a] ピリミジン [I I] 1モルに対して、塩基は通常1モル以上用いられる。用いることのできる塩基としては、例えば、ピリジン、2, 6-ルチジン、トリエチルアミン、N, N-ジイソプロピルエチルアミン、ジアザビスクロウンデセン (DBU)、ジ

アザビスクロノネン (DBN) 等の有機塩基類、炭酸カリウム、水素化ナトリウム等の無機塩基類が挙げられる。場合によっては、アミン [V] を過剰量用いることによって、塩基を用いるのと同様の効果を得ることができる。

- 5 該反応の反応温度は通常 0℃～200℃の間である。反応温度は、前記の範囲内にて、反応の速度に応じて適宜選択することができる。オートクレープを反応容器として用いると、アミン [V] または溶媒の沸点よりも高い温度で反応を行うことができる。

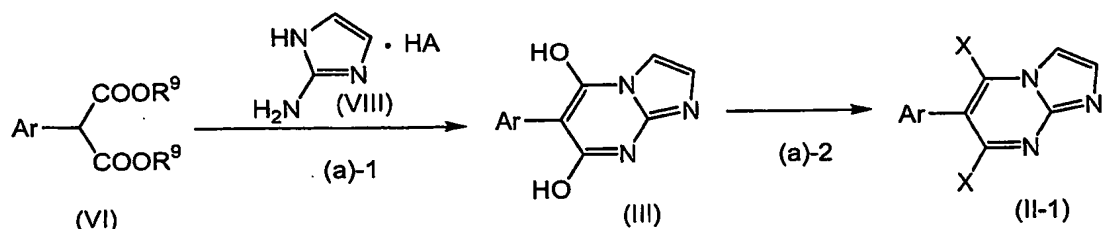
- 10 反応の終了は、薄層クロマトグラフィーや高速液体クロマトグラフィー等の手法により、イミダゾ [1, 2-a] ピリミジン [II] の残存量を分析することにより、確認することができる。

反応終了後は、反応液を水に注加した後、有機溶媒にて抽出し、濃縮する等の通常の後処理を行うことで本発明化合物を得ることができる。また得られた本発明化合物は、再結晶、クロマトグラフィー等により更に精製することもできる。

- 15 アミン [V] は公知の化合物であるか、公知の方法に準じて公知の化合物より製造することができる。

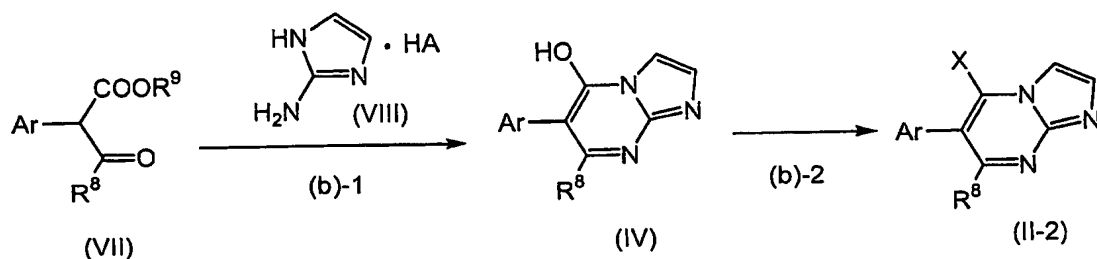
イミダゾ [1, 2-a] ピリミジン [II] は、下記のスキームに従って製造することができる。

- 20 (製造ルート a)



[式中、R<sup>9</sup> はメチル基またはエチル基を表し、HAは鉱酸（例えば、塩酸、硫酸）を表し、ArおよびXは前記と同じ意味を表す。]

(製造ルート b)



[式中、R<sup>8</sup> はC 1－C 4アルキル基を表し、R<sup>9</sup>、HA、Ar およびXは前記と同じ意味を表す。]

製造ルート (a) の出発原料であるジエステル [V I] は、公知の化合物 (例えば、特開平2-202876号、Chemistry Letters, 1981, p. 367に記載) であるか、公知の方法に準じて製造することができる。

製造ルート (b) の出発原料であるβ-ケトエステル [V I I] は、Organic Synthesis Collective Volume 2, p. 487-489および同p. 284-286、特開昭60-255788号等により公知であるか、公知の方法に準じて製造することができる。

10 製造ルート (a) および (b) における共通の出発原料である2-アミノイミダゾール鉍酸塩 [V I I I] は、J. Chem. Soc., 1956, p. 307、J. Org. Chem., 1964, p. 3118等により公知である。

#### 工程 (a) - 1

15 イミダゾ [1, 2-a] ピリミジン [I I I] は、ジエステル [V I] と2-アミノイミダゾール鉍酸塩 [V I I I] とを反応させることにより製造することができる。

20 ジエステル [V I] 1モルに対して、2-アミノイミダゾール鉍酸塩 [V I I I] は1モルが理論量であるが、反応の状況に応じて適宜変更することも可能である。該反応は、塩基の存在下、無溶媒かあるいは不活性溶媒中で50℃～200℃の温度で行なわれる。塩基としては、トリーn-ブチルアミン、ジアザビシクロウンデセン (DBU)、ジアザビシクロノネン (DBN) 等の有機塩基類が挙げられ、用いられる塩基の量は、ジエステル [V I] と2-アミノイミダゾール鉍酸塩 [V I I I] との合計1モルに対して、1モル以上である。用いられる溶

媒としては、例えば、メシチレン等の炭化水素類、N，N-ジメチルホルムアミド（DMF）等の非プロトン性極性溶媒が挙げられる。

反応の終了は、薄層クロマトグラフィーや高速液体クロマトグラフィー等の手法により、ジエステル [V I] の残存量を分析することにより、確認することができる。

反応終了後は、例えば、反応混合物に疎水性有機溶媒および水を加え、分液して得られる水層を、必要に応じて濃縮した後に、塩酸等の酸にて処理して生じる沈殿を濾取することにより、イミダゾ [1, 2-a] ピリミジン [I I I] を得ることができる。また、反応混合物を、必要に応じて濃縮した後に、沈殿を濾取することにより、イミダゾ [1, 2-a] ピリミジン [I I I] の塩を得ることもできる。得られたイミダゾ [1, 2-a] ピリミジン [I I I] は、再結晶等により更に精製することもできる。

#### 工程 (a) - 2

イミダゾ [1, 2-a] ピリミジン [I I] において、 $R^3$  がハロゲン原子である、イミダゾ [1, 2-a] ピリミジン [I I-1] は、イミダゾ [1, 2-a] ピリミジン [I I I] またはその塩と、ハロゲン化剤とを反応させることにより製造することができる。

該反応において、用いることのできるハロゲン化剤としては、例えば、オキシ塩化リン、オキシ臭化リンが挙げられる。

該反応は、無溶媒または不活性な溶媒（例えば、トルエン等の炭化水素類、アセトニトリル等のニトリル類、エチレンジクロリド等のハロゲン化炭化水素類）中、 $80^{\circ}\text{C} \sim 150^{\circ}\text{C}$ で行われる。該反応は塩基の存在に行うことにより反応が促進される場合があり、該塩基としては、例えば、N，N-ジエチルアニリン、N，N-ジメチルアニリン、トリエチルアミン、N，N-ジイソプロピルエチルアミン、ピリジン、5-エチル-2-ピコリン、DBU，DBN等の有機塩基類が挙げられる。

反応の終了は、薄層クロマトグラフィーや高速液体クロマトグラフィー等の手法により、イミダゾ [1, 2-a] ピリミジン [I I I] の残存量を分析すること

とにより、確認することができる。

反応終了後は、過剰のハロゲン化剤を除去した後に、残渣を水に注加した後、有機溶媒にて抽出し、濃縮する等の通常の後処理を行うことでイミダゾ [1, 2-a] ピリミジン [I I-1] を得ることができる。得られたイミダゾ [1, 2-a] ピリミジン [I I-1] は、再結晶、クロマトグラフィー等により更に精製することもできる。

#### 工程 (b) - 1

イミダゾ [1, 2-a] ピリミジン [I V] は、 $\beta$ -ケトエステル [V I I] と 2-アミノイミダゾール鈷酸塩 [V I I I] とを反応させることにより製造することができる。

$\beta$ -ケトエステル [V I I] の 1 モルに対して、2-アミノイミダゾール鈷酸塩 [V I I I] は 1 モルが理論量であるが、反応の状況に応じて適宜変更することも可能である。該反応は、塩基の存在下、無溶媒かあるいは不活性溶媒中で 50°C ~ 200°C の温度で行なわれる。塩基としては、トリー n-ブチルアミン、ジアザビスクロウンデセン (DBU)、ジアザビスクロノネン (DBN) 等の有機塩基類が挙げられ、用いられる塩基の量は、 $\beta$ -ケトエステル [V I I] と 2-アミノイミダゾール鈷酸塩 [V I I I] との合計 1 モルに対して、1 モル以上である。用いられる溶媒としては、例えば、メシチレン等の炭化水素類、N, N-ジメチルホルムアミド (DMF) 等の非プロトン性極性溶媒が挙げられる。

反応の終了は、薄層クロマトグラフィーや高速液体クロマトグラフィー等の手法により、 $\beta$ -ケトエステル [V I I] の残存量を分析することにより、確認することができる。

反応終了後は、例えば、反応混合物に疎水性有機溶媒および水を加え、分液して得られる水層を、必要に応じて濃縮した後に、塩酸等の酸にて処理して生じる沈殿を濾取することにより、イミダゾ [1, 2-a] ピリミジン [I V] を得ることができる。また、反応混合物を、必要に応じて濃縮した後に、沈殿を濾取することにより、イミダゾ [1, 2-a] ピリミジン [I V] の塩を得ることもできる。得られたイミダゾ [1, 2-a] ピリミジン [I V] は、再結晶等により更に精

製することもできる。

#### 工程 (b) - 2

イミダゾ [1, 2-a] ピリミジン [I I] において、 $R^3$ がC1-C4アルキル基である、イミダゾ [1, 2-a] ピリミジン [I I-2] は、イミダゾ [1, 2-a] ピリミジン [I V] またはその塩と、ハロゲン化剤とを反応させることにより製造することができる。

該反応において、用いることのできるハロゲン化剤としては、例えば、オキシ塩化リン、オキシ臭化リンが挙げられる。

10 該反応は、無溶媒または不活性な溶媒（例えば、トルエン等の炭化水素類、アセトニトリル等のニトリル類、エチレンジクロリド等のハロゲン化炭化水素類）中、80℃～150℃で行われる。該反応は塩基の存在下に行うことにより反応が促進させる場合があり、該塩基としては、例えば、N, N-ジエチルアニリン、N, N-ジメチルアニリン、トリエチルアミン、N, N-ジイソプロピルエチル  
15 アミン、ピリジン、5-エチル-2-ピコリン、DBU, DBN等の有機塩基類が挙げられる。

反応の終了は、薄層クロマトグラフィーや高速液体クロマトグラフィー等の手法により、イミダゾ [1, 2-a] ピリミジン [I V] の残存量を分析することにより、確認することができる。

20 反応終了後は、過剰のハロゲン化剤を除去した後に、残渣を水に注加した後、有機溶媒にて抽出し、濃縮する等の通常の後処理を行うことでイミダゾ [1, 2-a] ピリミジン [I I-2] を得ることができる。得られたイミダゾ [1, 2-a] ピリミジン [I I-2] は、再結晶、クロマトグラフィー等により更に精製することもできる。

25

本発明化合物を殺菌剤の有効成分として用いる場合、他の何らの成分も加えずそのまま用いてもよいが、通常は固体担体、液体担体、界面活性剤、その他の製剤用補助剤と混合して、乳剤、水和剤、顆粒水和剤、エマルション製剤、フロアブル製剤、粉剤、粒剤等に製剤して用いる。これらの製剤は、有効成分として本

発明化合物を重量%で通常0.1～90%含有する。

- かかる製剤化の際に用いられる固体担体としては、例えばカオリンクレー、ア  
ッタパルジャイトクレー、ベントナイト、モンモリロナイト、酸性白土、パイロ  
フィライト、タルク、珪藻土、方解石等の鉱物、トウモロコシ穂軸粉、クルミ殻  
5 粉等の天然有機物、尿素等の合成有機物、炭酸カルシウム、硫酸アンモニウム等  
の塩類、合成含水酸化珪素等の合成無機物等からなる微粉末あるいは粒状物等が  
挙げられ、液体担体としては、例えばキシレン、アルキルベンゼン、メチルナフ  
タレン等の芳香族炭化水素類、イソプロパノール、エチレングリコール、プロピ  
レングリコール、セロソルブ等のアルコール類、アセトン、シクロヘキサノン、  
10 イソホロン等のケトン類、ダイズ油、綿実油等の植物油、石油系脂肪族炭化水素  
類、エステル類、ジメチルスルホキシド、アセトニトリル、水が挙げられる。

- 界面活性剤としては、例えばアルキル硫酸エステル塩、アルキルアリールスル  
ホン酸塩、ジアルキルスルホコハク酸塩、ポリオキシエチレンアルキルアリール  
エーテルリン酸エステル塩、リグニンスルホン酸塩、ナフタレンスルホネートホ  
15 ルモアルデヒド重縮合物等の陰イオン界面活性剤、ポリオキシエチレンアルキル  
アリールエーテル、ポリオキシエチレンアルキルポリオキシプロピレンブロック  
コポリマー、ソルビタン脂肪酸エステル等の非イオン界面活性剤が挙げられる。

- 製剤用補助剤としては、例えばポリビニルアルコール、ポリビニルピロリドン  
等の水溶性高分子、アラビアガム、アルギン酸およびその塩、CMC（カルボキ  
20 シメチルセルロース）、ザンサンガム等の多糖類、アルミニウムマグネシウムシリ  
ケート、アルミナゾル等の無機物、防腐剤、着色剤、PAP（酸性リン酸イソプ  
ロピル）、BHT等の安定化剤が挙げられる。

- 本発明化合物を植物の病害防除に用いる場合、具体的には茎葉散布、土壌処理  
25 等の施用方法にて行われる。その施用量は、保護対象である植物の種類、防除対  
象である病害の種類、病害の発生程度、製剤形態、施用方法、施用時期、気象条  
件等によって変化させることができるが、1ヘクタールあたり通常1～5000  
g、好ましくは5～1000gである。乳剤、水和剤、懸濁剤等を水で希釈して  
施用する場合、有効成分の施用濃度は、0.0001～3重量%、好ましくは0.

0.005～1重量%であり、粉剤、粒剤等はなんら希釈することなくそのまま施用する。

- また、本発明化合物は種子消毒等の通常利用されるその他の施用方法で用いることもできる。種子消毒に用いる場合、通常1～1000 ppmの濃度に調製された本発明化合物の希釈液に種子を浸漬するか、又は該希釈液を種子に噴霧若しくは塗沫処理するか、あるいは本発明化合物を0.1～10重量%含有する粉剤にて湿粉衣処理する。

- 本発明化合物は、畑地、水田、果樹園、茶園、牧草地、芝生地等の植物病害を
- 10 防除するための殺菌剤として用いることができ、他の殺菌剤と混合して用いることにより、その殺菌効力の増強を期待できる場合がある。混合し得る他の殺菌剤としては、例えば、プロピコナゾール、トリアジメノール、プロクロラズ、ペンコナゾール、テブコナゾール、フルシラゾール、ジニコナゾール、ブロムコナゾール、エポキシコナゾール、ジフェノコナゾール、シプロコナゾール、メトコナ
- 15 ザール、トリフルミゾール、テトラコナゾール、マイクロブタニル、フェンブコナゾール、ヘキサコナゾール、フルキンコナゾール、トリティコナゾール、ピテルタノール、イマザリル及びフルトリアホール等のアゾール系殺菌化合物、フェンプロピモルフ、トリデモルフ及びフェンプロピジン等の環状アミン系殺菌化合物、カルベンダジム、ベノミル、チアベンダゾール、チオファネートメチル等の
- 20 ベンズイミダゾール系殺菌化合物、プロシミドン、シプロディニル、ピリメタニル、ジエトフェンカルブ、チウラム、フルアジナム、マンコゼブ、イプロジオン、ピンクロゾリン、クロロタロニル、キャプタン、メパニピリム、フェンピクロニル、フルジオキシニル、ジクロフルアニド、フォルペット、クレソキシムメチル、アゾキシストロビン、トリフロキシストロビン、ピコキシストロビン、ピラクロ
- 25 ストロビン、N-メチル- $\alpha$ -メトキシイミノ-2-[(2,5-ジメチルフェノキシ)メチル]フェニルアセトアミド、スピロキサミン、キノキシフェン、フェンヘキサミド、ファモキサドン、フェナミドン、イプロバリカルブ、ベンチアバリカルブ、ペンシクロン、フルトラニル、フラメトピル、フサライド、カルプロパミド、ジクロシメット、プロベナゾール、ブラシン、ジアゾファミド、ニコビ

フェン、メトラフェノン等が挙げられる。

本発明化合物は、他の農園芸用殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤、除草剤、植物生長調節剤、肥料と併用することもできる。併用に際しては、予め混合して使用することもできる。

- 5     かかる殺虫剤、殺ダニ剤及び殺線虫剤としては、例えばフェニトロチオン〔O, O-ジメチル O- (3-メチル-4-ニトロフェニル) ホスホロチオエート〕、フェンチオン〔O, O-ジメチル O- (3-メチル-4- (メチルチオ) フェニル) ホスホロチオエート〕、ダイアジノン〔O, O-ジエチル O-2-イソプロピル-6-メチルピリミジン-4-イルホスホロチオエート〕、クロルピリホス  
10   〔O, O-ジエチル O-3, 5, 6-トリクロロ-2-ピリジルホスホロチオエート〕、アセフェート〔O, S-ジメチルアセチルホスホラミドチオエート〕、メチダチオン〔S-2, 3-ジヒドロ-5-メトキシ-2-オキソ-1, 3, 4-チアジアゾール-3-イルメチル O, O-ジメチルホスホロジチオエート〕、ジスルホトン〔O, O-ジエチル S-2-エチルチオエチルホスホロチオエ  
15   ト〕、DDVP〔2, 2-ジクロロビニルジメチルホスフェート〕、スルプロホス〔O-エチル O-4- (メチルチオ) フェニル S-プロピルホスホロジチオエート〕、シアノホス〔O-4-シアノフェニル O, O-ジメチルホスホロチオエート〕、ジオキサベンゾホス〔2-メトキシ-4H-1, 3, 2-ベンゾジオキサホスフィニン-2-スルフィド〕、ジメトエート〔O, O-ジメチル S- (N-  
20   -メチルカルバモイルメチル) ジチオホスフェート〕、フェントエート〔エチル 2-ジメトキシホスフィノチオイルチオ (フェニル) アセテート〕、マラチオン〔ジエチル (ジメトキシホスフィノチオイルチオ) サクシネート〕、トリクロルホン〔ジメチル 2, 2, 2-トリクロロ-1-ヒドロキシエチルホスホネート〕、アジン  
ホスメチル〔S-3, 4-ジヒドロ-4-オキソ-1, 2, 3-ベンゾトリアジ  
25   ン-3-イルメチル O, O-ジメチルホスホロジチオエート〕、モノクロトホス〔ジメチル (E) -1-メチル-2- (メチルカルバモイル) ビニルホスフェート〕、エチオン〔O, O, O', O'-テトラエチル S, S'-メチレンビス (ホスホロジチオエート)〕、ホスチアゼート〔N- (O-メチル-S-sec-ブチル) ホスホリルチアゾリジン-2-オン〕等の有機リン系化合物、BPMC〔2-sec

- ーブチルフェニルメチルカーバメート]、ベンフラカルブ [エチル N- (2, 3-  
 ージヒドロ-2, 2-ジメチルベンゾフラン-7-イルオキシカルボニル (メチ  
 ル) アミノチオ) -N-イソプロピル-β-アラニネート]、プロポキスル [2-  
 5 イソプロポキシフェニル N-メチルカーバメート]、カルボスルファン [2, 3-  
 ージヒドロ-2, 2-ジメチル-7-ベンゾ [b] フラニル N-ジブチルアミ  
 ノチオ-N-メチルカーバメート]、カルバリル [1-ナフチル N-メチルカー  
 バメート]、メソミル [S-メチル-N- [(メチルカルバモイル) オキシ] チオ  
 アセトイミデート]、エチオフエンカルブ [2- (エチルチオメチル) フェニルメ  
 チルカーバメート]、アルジカルブ [2-メチル-2- (メチルチオ) プロピオン  
 10 アルデヒド O-メチルカルバモイルオキシム]、オキサミル [N, N-ジメチル  
 -2-メチルカルバモイルオキシイミノ-2- (メチルチオ) アセタミド]、フェ  
 ノチオカルブ [S-4-フェノキシブチル-N, N-ジメチルチオカーバメート  
 等のカーバメート系化合物、エトフェンブロックス [2- (4-エトキシフェニ  
 ル) -2-メチルプロピル-3-フェノキシベンジルエーテル]、フェンバレレー  
 15 ト [(R S) -α-シアノ-3-フェノキシベンジル (R S) -2- (4-クロ  
 ロフェニル) -3-メチルブチレート]、エスフェンバレレート [(S) -α-シ  
 アノ-3-フェノキシベンジル (S) -2- (4-クロロフェニル) -3-メ  
 チルブチレート]、フェンプロパトリン [(R S) -α-シアノ-3-フェノキシ  
 ベンジル 2, 2, 3, 3-テトラメチルシクロプロパンカルボキシレート]、シ  
 20 ペルメトリン [(R S) -α-シアノ-3-フェノキシベンジル (1 R S, 3 R  
 S) -3- (2, 2-ジクロロビニル) -2, 2-ジメチルシクロプロパンカル  
 ボキシレート]、ペルメトリン [3-フェノキシベンジル (1 R S, 3 R S) -  
 3- (2, 2-ジクロロビニル) -2, 2-メチルシクロプロパンカルボキシレ  
 ート]、シハロトリン [(R S) -α-シアノ-3-フェノキシベンジル (Z)  
 25 - (1 R S, 3 R S) -3- (2-クロロ-3, 3, 3-トリフロオロプロペニ  
 ル) -2, 2-ジメチルシクロプロパンカルボキシレート]、デルタメトリン [(S)  
 -α-シアノ-m-フェノキシベンジル (1 R, 3 R) -3- (2, 2-ジブ  
 ロモビニル) -2, 2-ジメチルシクロプロパンカルボキシレート]、シクロプロ  
 スリン [(R S) -α-シアノ-3-フェノキシベンジル (R S) -2, 2-ジ

クロロ-1-(4-エトキシフェニル)シクロプロパンカルボキシレート]、フル  
 バリネート[ $\alpha$ -シアノ-3-フェノキシベンジル N-(2-クロロ- $\alpha$ ,  $\alpha$ ,  
 $\alpha$ -トリフルオロ-p-トリル)-D-バリネート]、ビフェンスリン[2-メチ  
 ルビフェニル-3-イルメチル (Z)-(1RS)-cis-3-(2-クロロ-  
 5 3, 3, 3-トリフルオロプロプ-1-エニル)-2, 2-ジメチルシクロプロ  
 パンカルボキシレート]、アクリナスリン[(1R-{1 $\alpha$  (S\*), 3 $\alpha$  (Z)})  
 -2, 2-ジメチル-3-[3-オキソ-3-(2, 2, 2-トリフルオロ-1  
 -(トリフルオロメチル)エトキシ-1-プロペニル)シクロプロパンカルボン  
 酸シアノ(3-フェノキシフェノル)メチルエステル]]、2-メチル-2-(4  
 10 -ブロモジフルオロメトキシフェニル)プロピル(3-フェノキシベンジル)エ  
 ーテル、トラロメスリン[(S)- $\alpha$ -シアノ-3-フェノキシベンジル (1R)  
 -シス-3-(1, 2, 2, 2-テトラブromoエチル)-2, 2-ジメチルシク  
 ロプロパンカルボキシレート]、シラフルオフエン[[4-エトキシフェニル(3  
 -(4-フルオロ-3-フェノキシフェニル)プロピル)ジメチルシラン]等の  
 15 ピレスロイド化合物、ブプロフェジン(2-t-ブチルイミノ-3-イソプロピ  
 ル-5-フェニル-1, 3, 5-トリアジアジナン-4-オン)等のチアジアジ  
 ン誘導体、ニトロイミダゾリジン誘導体、カルタップ(S, S'-(2-ジメチル  
 アミノトリメチレン)ビス(チオカーバメート))、チオシクラム[N, N-ジメ  
 チル-1, 2, 3-トリチアン-5-イルアミン]、ベンスルタップ[S, S'-  
 20 2-ジメチルアミノトリメチレン ジ(ベンゼンチオサルフォネート)]等のネラ  
 イストキシシン誘導体、N-シアノ-N'-メチル-N'-(6-クロロ-3-ピリジ  
 ルメチル)アセトアミジン等のN-シアノアミジン誘導体、エンドスルファン[6,  
 7, 8, 9, 10, 10-ヘキサクロロ-1, 5, 5a, 6, 9, 9a-ヘキサ  
 ヒドロ-6, 9-メタノ-2, 4, 3-ベンゾジオキサチエピンオキサイド]、 $\gamma$   
 25 -BHC(1, 2, 3, 4, 5, 6-ヘキサクロロシクロヘキサン)、1, 1-ビス  
 (クロロフェニル)-2, 2, 2-トリクロロエタノール等の塩素化炭化水素  
 化合物、クロルフルアズロン[1-(3, 5-ジクロロ-4-(3-クロロ-5  
 -トリフルオロメチルピリジン-2-イルオキシ)フェニル)-3-(2, 6-  
 ジフルオロベンゾイル)ウレア]、テフルベンズロン[1-(3, 5-ジクロロ-

2, 4-ジフルオロフェニル) - 3 - (2, 6-ジフルオロベンゾイル) ウレア]、  
 フルフェノクスロン [1 - (4 - (2-クロロ-4-トリフルオロメチルフェノ  
 キシ) - 2-フルオロフェニル) - 3 - (2, 6-ジフルオロベンゾイル) ウレ  
 ア] 等のベンゾイルフェニルウレア系化合物、アミトラズ [N, N' [(メチルイ  
 5 ミノ) ジメチリジン] ジ-2, 4-キシリジン]、クロルジメホルム [N'- (4  
 -クロロ-2-メチルフェニル) - N, N-ジメチルメタニミダミド] 等のホル  
 ムアミジン誘導体、ジアフェンチウロン [N - (2, 6-ジイソプロピル-4-  
 フェノキシフェニル) - N' - t-ブチルカルボジイミド] 等のチオ尿素誘導体、  
 フェニルピラゾール系化合物、テブフェノジド [N - t-ブチル-N' - (4-エ  
 10 チルベンゾイル) - 3, 5-ジメチルベンゾヒドラジド]、4-ブromo-2 - (4  
 -クロロフェニル) - 1-エトキシメチル-5-トリフルオロメチルピロール-  
 3-カルボニトリル、ブromoproピレート [イソプロピル 4, 4'-ジブromoベ  
 ンジレート]、テトラジホン [4-クロロフェニル 2, 4, 5-トリクロロフェ  
 ニルスルホン]、キノメチオネート [S, S-6-メチルキノキサリン-2, 3-  
 15 ジイルジチオカルボネート]、プロパルゲイト [2 - (4-t-ブチルフェノキシ)  
 シクロヘキシル プロプ-2-イル スルファイト]、フェンブタティン オキシ  
 ド [ビス [トリス (2-メチル-2-フェニルプロピル) ティン] オキシド]、ヘ  
 キシチアゾクス [(4RS, 5RS) - 5 - (4-クロロフェニル) - N-クロロ  
 ヘキシル-4-メチル-2-オキソ-1, 3-チアゾリジン-3-カルボキサミ  
 20 ド]、クロフェンテジン [3, 6-ビス (2-クロロフェニル) - 1, 2, 4, 5  
 -テトラジン、ピリダチオベン [2-t-ブチル-5 - (4-t-ブチルベンジ  
 ルチオ) - 4-クロロピリダジン-3 (2H) -オン]、フェンピロキシメート [t  
 -ブチル (E) - 4 - [(1, 3-ジメチル-5-フェノキシピラゾール-4-イ  
 ル) メチレンアミノオキシメチル] ベンゾエート]、テブフェンピラド [N-4-  
 25 t-ブチルベンジル] - 4-クロロ-3-エチル-1-メチル-5-ピラゾール  
 カルボキサミド]、ポリナクチンコンプレックス [テトラナクチン、ジナクチン、  
 トリナクチン]、ミルベメクチン、アベルメクチン、イバーメクチン、アザジラク  
 チン [AZAD]、ピリミジフェン [5-クロロ-N - [2 - {4 - (2-エトキシ  
 エチル) - 2, 3-ジメチルフェノキシ} エチル] - 6-エチルピリミジン-

4-アミン、ピメトロジン〔2, 3, 4, 5-テトラヒドロ-3-オキソ-4-  
〔(ピリジン-3-イル)-メチレンアミノ〕-6-メチル-1, 2, 4-トリア  
ジン等が挙げられる。

- 5 本発明化合物により防除することができる植物病害としては、例えば、イネの  
いもち病 (*Pyricularia oryzae*)、ごま葉枯病 (*Cochliobolus miyabeanus*)、紋枯  
病 (*Rhizoctonia solani*)、ムギ類のうどんこ病 (*Erysiphe graminis*)、赤かび病  
(*Gibberella zeae*)、さび病 (*Puccinia striiformis*, *P. graminis*, *P. recondita*,  
*P. hordei*)、雪腐病 (*Typhula* sp., *Micronectriella nivalis*)、裸黒穂病 (*Ustilago*  
10 *tritici*, *U. nuda*)、なまぐさ黒穂病 (*Tilletia caries*)、眼紋病  
(*Pseudocercospora herpotrichoides*)、雲形病 (*Rhynchosporium secalis*)、  
葉枯病 (*Septoria tritici*)、ふ枯病 (*Leptosphaeria nodorum*)、カンキツ類の黒  
点病 (*Diaporthe citri*)、そうか病 (*Elsinoe fawcetti*)、果実腐敗病 (*Penicillium*  
*digitatum*, *P. italicum*)、リンゴのモニリア病 (*Sclerotinia mali*)、腐らん病  
15 (*Valsa mali*)、うどんこ病 (*Podosphaera leucotricha*)、斑点落葉病 (*Alternaria*  
*mali*)、黒星病 (*Venturia inaequalis*)、ナシの黒星病 (*Venturia nashicola*, *V.*  
*pirina*)、黒斑病 (*Alternaria kikuchiana*)、赤星病 (*Gymnosporangium haraeae*)、  
モモの灰星病 (*Sclerotinia cinerea*)、黒星病 (*Cladosporium carpophilum*)、フ  
ォモプシス腐敗病 (*Phomopsis* sp.)、ブドウの黒とう病 (*Elsinoe ampelina*)、晩  
20 腐病 (*Glomerella cingulata*)、うどんこ病 (*Uncinula necator*)、さび病 (*Phakopsora*  
*ampelopsidis*)、ブラックロット病 (*Guignardia bidwellii*)、べと病 (*Plasmopara*  
*viticola*)、カキの炭そ病 (*Gloeosporium kaki*)、落葉病 (*Cercospora kaki*,  
*Mycosphaerella nawae*)、ウリ類の炭そ病 (*Colletotrichum lagenarium*)、うどん  
こ病 (*Sphaerotheca fuliginea*)、つる枯病 (*Mycosphaerella melonis*)、つる割病  
25 (*Fusarium oxysporum*)、べと病 (*Pseudoperonospora cubensis*)、疫病  
(*Phytophthora* sp.)、苗立枯病 (*Pythium* sp.)、トマトの輪紋病 (*Alternaria*  
*solani*)、葉かび病 (*Cladosporium fulvum*)、疫病 (*Phytophthora infestans*)、  
ナスの褐紋病 (*Phomopsis vexans*)、うどんこ病 (*Erysiphe cichoracearum*)、ア  
ブラナ科野菜の黒斑病 (*Alternaria japonica*)、白斑病 (*Cercospora brassicae*)、

ネギのさび病 (*Puccinia allii*)、ダイズの紫斑病 (*Cercospora kikuchii*)、黒とう病 (*Elsinoe glycines*)、黒点病 (*Diaporthe phaseolorum* var. *sojae*)、インゲンの炭そ病 (*Colletotrichum lindemthianum*)、ラッカセイの黒渋病 (*Cercospora personata*)、褐斑病 (*Cercospora arachidicola*)、エンドウのうどんこ病 (*Erysiphe pisi*)、ジャガイモの夏疫病 (*Alternaria solani*)、疫病 (*Phytophthora infestans*)、イチゴのうどんこ病 (*Sphaerotheca humuli*)、チャの網もち病 (*Exobasidium reticulatum*)、白星病 (*Elsinoe leucospila*)、タバコの赤星病 (*Alternaria longipes*)、うどんこ病 (*Erysiphe cichoracearum*)、炭そ病 (*Colletotrichum tabacum*)、べと病 (*Peronospora tabacina*)、疫病 (*Phytophthora nicotianae*)、

10 テンサイの褐斑病 (*Cercospora beticola*)、バラの黒星病 (*Diplocarpon rosae*)、うどんこ病 (*Sphaerotheca pannosa*)、キクの褐斑病 (*Septoria chrysanthemi-indici*)、白さび病 (*Puccinia horiana*)、種々の作物の灰色かび病 (*Botrytis cinerea*)、菌核病 (*Sclerotinia sclerotiorum*) 等の病害を挙げることができる。

15 以下、本発明を製造例、製剤例及び試験例等によりさらに詳しく説明するが、本発明は、これらの例に限定されるものではない。

まず、本発明化合物の製造例を示す。

#### 製造例 1

5 - (4-メチルピペリジン-1-イル) - 6 - (2, 4, 6トリフルオロフェニル) - 7-クロロイミダゾ [1, 2-a] ピリミジン (化合物番号 55)

20

(a) (2, 4, 6-トリフルオロフェニル) マロン酸ジエチルの製造

水素化ナトリウム (60%油性) 4.8 g と 1, 4-ジオキサン 100 ml との混合物に、室温でマロン酸ジエチル 19.2 g を滴下した後、40℃で臭化銅 (I) 17.2 g と 1-ブロモ-2, 4, 6-トリフルオロベンゼン 21.1 g

25 とを順次加え、26時間加熱還流した。反応混合物に氷冷下濃塩酸を加えた後、tert-ブチルメチルエーテルと水とを加え、分液した。有機層を水酸化ナトリウム水溶液、希塩酸、水で順次洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付して (2, 4, 6-トリフルオロフェニル) マロン酸ジエチル 12.6 g を得た。

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3, \text{TMS}) \delta (\text{ppm})$ : 1.28 (3H, t,  $J=7.1\text{Hz}$ ), 4.26 (2H, q,  $J=7.1\text{Hz}$ ), 4.89 (1H, s), 6.71 (2H, t,  $J=8.2\text{Hz}$ )

(b) 5, 7-ジヒドロキシー-6-(2, 4, 6-トリフルオロフェニル)イミダゾ[1, 2-a]ピリミジンの製造

5 (2, 4, 6-トリフルオロフェニル)マロン酸ジエチル2.90 gと2-アミノイミダゾール塩酸塩2.39 gとDBU4.57 gとN, N-ジメチルホルムアミド10 mlとの混合物を100°Cで6時間加熱した。反応混合物を室温まで放冷した後、クロロホルムと水を加え、分液した。水層を濃縮し、残渣を水に希釈し、氷冷下に濃塩酸を加えた。析出した沈殿を濾取、乾燥して5, 7-ジヒ  
10 ドロキシー-6-(2, 4, 6-トリフルオロフェニル)イミダゾ[1, 2-a]ピリミジン2.2 gを得た。

(c) 5, 7-ジクロロ-6-(2, 4, 6-トリフルオロフェニル)イミダゾ[1, 2-a]ピリミジンの製造

5, 7-ジヒドロキシー-6-(2, 4, 6-トリフルオロフェニル)イミダゾ  
15 [1, 2-a]ピリミジン2.11 gとオキシ塩化リン5 mlとの混合物を、還流条件下24時間加熱した。反応混合物を濃縮した後、残渣にジクロロメタンと飽和炭酸水素ナトリウム水溶液とを加え、分液した。有機層を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、飽和食塩水で順次洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、5, 7-ジクロロ-6  
20 - (2, 4, 6-トリフルオロフェニル)イミダゾ[1, 2-a]ピリミジン1.39 gを得た。

(d) 5-(4-メチルピペリジン-1-イル)-6-(2, 4, 6-トリフルオロフェニル)-7-クロロイミダゾ[1, 2-a]ピリミジンの製造

5, 7-ジクロロ-6-(2, 4, 6-トリフルオロフェニル)イミダゾ[1, 2-a]ピリミジン0.64 gと4-メチルピペリジン0.79 gとを、氷冷下  
25 混合した。室温に戻して1時間後、反応混合物にクロロホルムと飽和塩化アンモニウム水溶液とを加え、分液した。有機層を水洗し、硫酸ナトリウムで乾燥後、濃縮した。残渣をt-ブチルメチルエーテルで洗浄して、5-(4-メチルピペリジン-1-イル)-6-(2, 4, 6-トリフルオロフェニル)-7-クロロ

イミダゾ [1,2-a] ピリミジン 0.62 g を得た。

## 製造例 2

5 5-(4-メチルピペリジン-1-イル)-6-(2-クロロ-6-フルオロフェニル)-7-クロロイミダゾ [1,2-a] ピリミジン (化合物番号 182)

(a) (2-クロロ-6-フルオロフェニル) マロン酸ジエチルの製造

水素化ナトリウム (60%油性) 7.2 g と炭酸ジエチル 17.0 g とテトラヒドロフラン 150 ml との混合物に、還流条件下に、2-クロロ-6-フルオロフェニル酢酸エチル 26.0 g を滴下し、8 時間還流条件下に加熱した。反応  
10 混合物を放冷後、氷冷した希塩酸へ注加し、t-ブチルメチルエーテルで抽出した。有機層を水洗し、硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮した。残渣をシリカゲルクロマトグラフィーに付し、(2-クロロ-6-フルオロフェニル) マロン酸ジエチル 30.4 g を得た。

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3, \text{TMS}) \delta (\text{ppm})$ : 1.28 (3H, t,  $J=7.1\text{Hz}$ ), 4.26 (2H, q,  $J=7.1\text{Hz}$ ), 5.16 (1H, s), 7.0-7.1 (1H, m), 7.2-7.4 (2H, m)  
15

(b) 5, 7-ジヒドロキシ-6-(2-クロロ-6-フルオロフェニル) イミダゾ [1,2-a] ピリミジン・DBN 塩の製造

(2-クロロ-6-フルオロフェニル) マロン酸ジエチル 2.89 g とアミノイミダゾール塩酸塩 1.20 g と 1, 5-ジアザビシクロ [4, 3, 0] -5-  
20 ノネン (DBN) 2.48 g と N, N-ジメチルホルムアミド (DMF) 10 ml との混合物を、100°C で 4 時間加熱した。反応混合物を放冷後、析出した沈殿を濾取、乾燥し、5, 7-ジヒドロキシ-6-(2-クロロ-6-フルオロフェニル) イミダゾ [1,2-a] ピリミジン・DBN 塩 1.80 g を得た。

(c) 5, 7-ジクロロ-6-(2-クロロ-6-フルオロフェニル) イミダゾ  
25 [1,2-a] ピリミジンの製造

5, 7-ジヒドロキシ-6-(2-クロロ-6-フルオロフェニル) イミダゾ [1,2-a] ピリミジン・DBN 塩 1.62 g とオキシ塩化リン 5 ml との混合物を 10 時間、還流条件下に加熱した。反応混合物を濃縮した。残渣にジクロロメタンと飽和炭酸水素ナトリウム水溶液とを加え、分液した。有機層を飽和炭酸

水素ナトリウム水溶液および水で順次洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮した。残渣をシリカゲルクロマトグラフィーに付し、5, 7-ジクロロ-6-(2-クロロ-6-フルオロフェニル)イミダゾ[1,2-a]ピリミジン1.00 gを得た。

- 5 (d) 5-(4-メチルピペリジン-1-イル)-6-(2-クロロ-6-フルオロフェニル)-7-クロロイミダゾ[1,2-a]ピリミジンの製造

5, 7-ジクロロ-6-(2-クロロ-6-フルオロフェニル)イミダゾ[1,2-a]ピリミジン0.63 gと4-メチルピペリジン0.79 gとを、氷冷下混合した。室温に戻して10分後、反応混合物にクロロホルムと水とを加え、分  
10 液した。有機層を水洗し、硫酸ナトリウムで乾燥後、濃縮した。残渣をシリカゲルクロマトグラフィーに付し、5-(4-メチルピペリジン-1-イル)-6-(2-クロロ-6-フルオロフェニル)-7-クロロイミダゾ[1,2-a]ピリミジン0.73 gを得た。

### 15 製造例3

5-(4-メチルピペリジン-1-イル)-6-(2-クロロ-6-フルオロフェニル)-7-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリミジン (化合物番号428)

(a) 2-(2-クロロ-6-フルオロフェニル)アセト酢酸エチルの製造

水素化ナトリウム(60%油性)9.6 gとテトラヒドロフラン200 mlとの混合物に、還流条件下に2-クロロ-6-フルオロフェニル酢酸エチル21.7 gを滴下した。その後、還流条件下、無水酢酸12.3 gのテトラヒドロフラン40 ml溶液を滴下し、10時間還流条件下に加熱した。反応混合物を放冷後、氷冷した希塩酸へ注加し、t-ブチルメチルエーテルで抽出した。有機層を希塩酸、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、希塩酸、水で順次洗浄し、硫酸ナトリウム  
25 で乾燥した後、濃縮した。残渣をシリカゲルクロマトグラフィーに付し、2-(2-クロロ-6-フルオロフェニル)アセト酢酸エチル9.27 gを得た。

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3, \text{TMS}) \delta (\text{ppm})$ : 1.17 (3H, t,  $J=7.1\text{Hz}$ ), 1.82 (3H, s), 4.1-4.3 (2H, m), 6.9-7.1 (1H, m), 7.2-7.3 (2H, m), 13.2 (1H, s)

(b) 5-ヒドロキシ-6-(2-クロロ-6-フルオロフェニル)-7-メチ

## ルイミダゾ [1, 2-a] ピリミジンの製造

- 2- (2-クロロ-6-フルオロフェニル) アセト酢酸エチル 1.29 g とアミノイミダゾール塩酸塩 0.60 g と 1, 5-ジアザビシクロ [4, 3, 0] -5-ノネン (DBN) 1.24 g と N, N-ジメチルホルムアミド 5 ml との混合物を、100℃で14時間加熱した。反応混合物を放冷後、クロロホルムと水とを加え、分液した。水層に濃塩酸を加え、析出した沈殿を濾取した。濾過物をシリカゲルクロマトグラフィーに付し、5-ヒドロキシ-6- (2-クロロ-6-フルオロフェニル) -7-メチルイミダゾ [1, 2-a] ピリミジン 0.16 g を得た。

- 10 (c) 5-クロロ-6- (2-クロロ-6-フルオロフェニル) -7-メチルイミダゾ [1, 2-a] ピリミジンの製造

- 5-ヒドロキシ-6- (2-クロロ-6-フルオロフェニル) -7-メチルイミダゾ [1, 2-a] ピリミジン 0.16 g と N, N-ジエチルアニリン 0.20 g とオキシ塩化リン 2 ml との混合物を 26 時間還流条件下に加熱した。反応混合物を濃縮した後、残渣にジクロロメタンと飽和炭酸水素ナトリウム水溶液とを加え、分液した。有機層を、水洗し、硫酸ナトリウムで乾燥後、濃縮した。残渣をシリカゲルクロマトグラフィーに付し、5-クロロ-6- (2-クロロ-6-フルオロフェニル) -7-メチルイミダゾ [1, 2-a] ピリミジン 45 mg を得た。

- 20 (d) 5- (4-メチルピペリジン-1-イル) -6- (2-クロロ-6-フルオロフェニル) -7-メチルイミダゾ [1, 2-a] ピリミジンの製造

- 5-クロロ-6- (2-クロロ-6-フルオロフェニル) -7-メチルイミダゾ [1, 2-a] ピリミジン 45 mg (0.16 mmol) と 4-メチルピペリジン 63 mg (0.64 mmol) とを室温で混合した。1時間後、反応混合物にクロロホルムと飽和塩化アンモニウム水溶液とを加え、分液した。有機層を飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮した。残渣をシリカゲルクロマトグラフィーに付し、5- (4-メチルピペリジン-1-イル) -6- (2-クロロ-6-フルオロフェニル) -7-メチルイミダゾ [1, 2-a] ピリミジン 35 mg (0.10 mmol, 61%) を得た。

## 製造例 4

5-アミノ-6-(2, 4, 6-トリフルオロフェニル)-7-クロロイミダゾ  
[1, 2-a] ピリミジン (化合物番号 1)

- 5     5, 7-ジクロロ-6-(2, 4, 6-トリフルオロフェニル) イミダゾ [1, 2-a] ピリミジン 0.48 g (1.5 mmol) とアンモニア水 5 ml とエタノール 10 ml との混合物を、8 時間還流条件下に加熱した。反応混合物を濃縮した後、残渣に水を加え、沈殿を濾取、乾燥して、5-アミノ-6-(2, 4, 6-トリフルオロフェニル)-7-クロロイミダゾ [1, 2-a] ピリミジン 0.30 g (1.0 mmol, 68%) を得た。

## 製造例 5

5-(ジ-n-プロピルアミノ)-6-(2, 4, 6-トリフルオロフェニル)-7-クロロイミダゾ [1, 2-a] ピリミジン (化合物番号 8)

- 15     5, 7-ジクロロ-6-(2, 4, 6-トリフルオロフェニル) イミダゾ [1, 2-a] ピリミジン 0.095 g とジ-n-プロピルアミン 0.12 g との混合物を 80°C で 1 時間加熱した。反応混合物を放冷した後、クロロホルムと水とを加え、分液した。有機層を硫酸ナトリウムで乾燥後、濃縮した。残渣をシリカゲルクロマトグラフィーに付し、5-(ジ-n-プロピルアミノ)-6-(2, 4, 6-トリフルオロフェニル)-7-クロロイミダゾ [1, 2-a] ピリミジン 0.095 g を得た。

## 製造例 6

- 25     5-(2-メチルピペリジン-1-イル)-6-(2, 4, 6-トリフルオロフェニル)-7-クロロイミダゾ [1, 2-a] ピリミジン (化合物番号 53)

5, 7-ジクロロ-6-(2, 4, 6-トリフルオロフェニル) イミダゾ [1, 2-a] ピリミジン 0.63 g と 2-メチルピペリジン 0.79 g とクロロホルム 2 ml との混合物を 80°C で 1 時間加熱した。反応混合物を放冷した後、シリカゲルクロマトグラフィーに付し、5-(2-メチルピペリジン-1-イル)-

6-(2, 4, 6-トリフルオロフェニル)-7-クロロイミダゾ[1, 2-a]ピリミジン0.30gを得た。

#### 製造例7

- 5 5-(ヘキサメチレンイミン-1-イル)-6-(2, 4, 6-トリフルオロフェニル)-7-クロロイミダゾ[1, 2-a]ピリミジン (化合物番号72)

5, 7-ジクロロ-6-(2, 4, 6-トリフルオロフェニル)イミダゾ[1, 2-a]ピリミジン0.32gとヘキサメチレンイミン0.40gとを室温で混合した。18時間後、反応混合物に水を加え、析出した沈殿を濾取した。濾過物をシリカゲルクロマトグラフィーに付し、5-(ヘキサメチレンイミン-1-イル)-6-(2, 4, 6-トリフルオロフェニル)-7-クロロイミダゾ[1, 2-a]ピリミジン0.35gを得た。

#### 製造例8

- 15 5-(3, 5-ジメチルピラゾール-1-イル)-6-(2, 4, 6-トリフルオロフェニル)-7-クロロイミダゾ[1, 2-a]ピリミジン (化合物番号89)

水素化ナトリウム(60%油性)0.040gとテトラヒドロフラン2mlとの混合物に、3, 5-ジメチルピラゾール0.096gのテトラヒドロフラン溶液(3ml)を滴下した。該混合物を、5, 7-ジクロロ-6-(2, 4, 6-トリフルオロフェニル)イミダゾ[1, 2-a]ピリミジン0.32gのテトラヒドロフラン溶液(5ml)に氷冷下滴下した。反応混合物にクロロホルムとクエン酸水溶液とを加え、分液した。有機層を水洗し、硫酸ナトリウムで乾燥後、濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィーに付し、5-(3, 5-ジメチルピラゾール-1-イル)-6-(2, 4, 6-トリフルオロフェニル)-7-クロロイミダゾ[1, 2-a]ピリミジン0.18gを得た。

#### 製造例9

5-(ヘキサメチレンイミン-1-イル)-6-(2, 6-ジフルオロフェニル)-7-クロロイミダゾ[1, 2-a]ピリミジン (化合物番号233)

## (a) (2, 6-ジフルオロフェニル) マロン酸ジエチルの製造

水素化ナトリウム (60%油性) 8.00 g と 1, 4-ジオキサン 100 ml との混合物に、60℃でマロン酸ジエチル 32.0 g を滴下した後、臭化銅 (I) 14.6 g と 1-ブロモ-2, 6-ジフルオロベンゼン 19.3 g とを順次加え、16時間加熱還流した。反応混合物に氷冷下濃塩酸を加えた後、tert-ブチルメチルエーテルと水とを加え、分液した。有機層を希塩酸、水で順次洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮した。残渣を減圧下に蒸留し、(2, 6-ジフルオロフェニル) マロン酸ジエチル 16.5 g を得た。

沸点 : 107℃ - 109℃ (0.14 mm Hg)

## 10 (b) 5, 7-ジヒドロキシ-6-(2, 6-ジフルオロフェニル) イミダゾ [1, 2-a] ピリミジンの製造

(2, 6-ジフルオロフェニル) マロン酸ジエチル 13.6 g、2-アミノイミダゾール硫酸塩 7.93 g、DBU 9.13 g および N, N-ジメチルホルムアミド 30 ml の混合物を 100℃で7時間加熱した。反応混合物に水を加え、室温まで放冷した後、tert-ブチルメチルエーテルとで分液した。水層に濃塩酸を加え、析出した沈殿を濾取、乾燥して 5, 7-ジヒドロキシ-6-(2, 4, 6-トリフルオロフェニル) イミダゾ [1, 2-a] ピリミジン 7.84 g を得た。

## 15 (c) 5, 7-ジクロロ-6-(2, 6-ジフルオロフェニル) イミダゾ [1, 2-a] ピリミジンの製造

5, 7-ジヒドロキシ-6-(2, 6-ジフルオロフェニル) イミダゾ [1, 2-a] ピリミジン 7.63 g と DBU 4.85 g と オキシ塩化リン 29 ml との混合物を、還流条件下 10 時間加熱した。反応混合物を濃縮した後、残渣にクロロホルムと飽和炭酸水素ナトリウム水溶液とを加え、分液した。有機層を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、飽和食塩水で順次洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、5, 7-ジクロロ-6-(2, 6-ジフルオロフェニル) イミダゾ [1, 2-a] ピリミジン 2.48 g を得た。

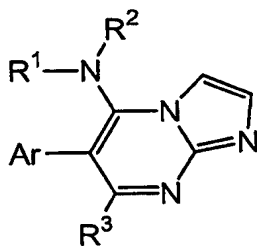
## 25 (d) 5-(ヘキサメチレンイミン-1-イル)-6-(2, 6-ジフルオロフ

エニル) -7-クロロイミダゾ [1,2-a] ピリミジンの製造

- 5,7-ジクロロ-6-(2,6-ジフルオロフェニル) イミダゾ [1,2-a] ピリミジン 0.30 g とヘキサメチレンイミン 0.79 g とクロロホルム 0.5 ml とを、室温で混合した。反応混合物をシリカゲルクロマトグラフィーに付し、
- 5 5-(ヘキサメチレンイミン-1-イル) -6-(2,6-ジフルオロフェニル) -7-クロロイミダゾ [1,2-a] ピリミジン 0.26 g を得た。

- 以下に、前述の製造方法およびそれに準じた製造方法により製造される本発明化合物を化合物番号とともに例示するが、本発明化合物はこれらの例示に限定されない。
- 10

下式



で示される化合物。

表 1

化合物番号	R <sup>1</sup> R <sup>2</sup> N	Ar	R <sup>3</sup>
1	NH <sub>2</sub>	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
2	MeNH	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
3	EtNH	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
4	i-PrNH	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
5	BuNH	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
6	Me <sub>2</sub> N	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
7	Et <sub>2</sub> N	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
8	Pr <sub>2</sub> N	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
9	Bu <sub>2</sub> N	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
10	(i-Bu) <sub>2</sub> N	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
11	(CF <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> )NH	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
12	[CF <sub>3</sub> CH(Me)]NH	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
13	(CF <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> )(Me)N	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
14	(CF <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> )(Et)N	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
15	(CF <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> )(CH <sub>2</sub> =CHCH <sub>2</sub> )N	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
16	(CF <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> )(i-Bu)N	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
17	c-PrNH	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
18	c-BuNH	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
19	c-PentNH	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
20	c-HexNH	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
21	(c-Hex)(Me)N	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
22	(2-Me-c-Hex)NH	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
23	(3-Me-c-Hex)NH	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
24	(4-Me-c-Hex)NH	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
25	c-HepNH	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl

(表 1 の続き)

化合物番号	$R^1R^2N$	Ar	$R^3$
26	c-OctNH	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
27	(CH <sub>2</sub> =CHCH <sub>2</sub> )NH	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
28	[CH <sub>2</sub> =C(Me)CH <sub>2</sub> ]NH	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
29	(CH <sub>2</sub> =CHCH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> N	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
30	[CH <sub>2</sub> =C(Me)CH <sub>2</sub> ] <sub>2</sub> N	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
31	(CH≡CCH <sub>2</sub> )NH	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
32	(CH≡CCH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> N	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
33	(Me <sub>2</sub> NCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> )NH	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
34	(MeOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> )NH	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
35	(EtOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> )NH	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
36	[(MeO) <sub>2</sub> CHCH <sub>2</sub> ]NH	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
37	[(EtO) <sub>2</sub> CHCH <sub>2</sub> ]NH	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
38	[(MeO) <sub>2</sub> CHCH <sub>2</sub> ](Me)N	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
39	(MeSCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> )NH	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
40	(MeSCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> )NH	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
41	[(MeOOC)CH <sub>2</sub> ]NH	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
42	[(EtOOC)CH <sub>2</sub> ]NH	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
43	(N≡CCH <sub>2</sub> )NH	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
44	(N≡CCH <sub>2</sub> )(Me)N	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
45	(N≡CCH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> N	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
46	(2-Me-Z1)	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
47	Z2	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
48	Z3	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
49	(2-Me-Z3)	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
50	(2,5-Me <sub>2</sub> -Z3)	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl

(表 1 の続き)

化合物番号	R <sup>1</sup> R <sup>2</sup> N	Ar	R <sup>3</sup>
51	Z4	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
52	Z5	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
53	(2-Me-Z5)	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
54	(3-Me-Z5)	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
55	(4-Me-Z5)	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
56	(2-CF <sub>3</sub> -Z5)	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
57	(4-CF <sub>3</sub> -Z5)	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
58	(3-Cl-Z5)	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
59	(4-Cl-Z5)	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
60	(3-F-Z5)	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
61	(4-F-Z5)	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
62	(3,3-Me <sub>2</sub> -Z5)	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
63	(3,5-Me <sub>2</sub> -Z5)	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
64	(2,6-Me <sub>2</sub> -Z5)	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
65	(2-Et-Z5)	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
66	(3-HO-Z5)	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
67	(4-HO-Z5)	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
68	(2-EtOOC-Z5)	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
69	(3-EtOOC-Z5)	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
70	(4-EtOOC-Z5)	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
71	Z6	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
72	Z7	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
73	(2-Me-Z7)	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
74	Z8	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
75	(2-Me-Z9)	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl

(表1の続き)

化合物番号	R <sup>1</sup> R <sup>2</sup> N	Ar	R <sup>3</sup>
76	(4-Me-Z10)	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
77	(4-Ac-Z10)	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
78	(4-EtOOC-Z10)	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
79	(4-t-BuOOC-Z10)	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
80	Z11	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
81	Z12	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
82	(2,6-Me <sub>2</sub> -Z12)	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
83	Z13	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
84	Z14	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
85	Z15	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
86	(4-Me-Z15)	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
87	(4-Br-Z15)	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
88	(4-EtOOC-Z15)	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
89	(3,5-Me <sub>2</sub> -Z15)	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
90	[3,5-(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -Z15]	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
91	Z16	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
92	[4,5-(NO <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -Z16]	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
93	PhNH	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
94	(Ph)(Me)N	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
95	(4-Me-Ph)NH	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
96	(4-F-Ph)NH	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
97	(4-CF <sub>3</sub> -Ph)NH	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
98	(4-Cl-Ph)NH	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
99	(4-Br-Ph)NH	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
100	(4-MeO-Ph)NH	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl

(表 1 の続き)

化合物番号	R <sup>1</sup> R <sup>2</sup> N	Ar	R <sup>3</sup>
101	(4-CF <sub>3</sub> O-Ph)NH	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
102	(4-MeS-Ph)NH	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
103	(4-MeOOC-Ph)NH	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
104	(4-Cyano-Ph)NH	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
105	(4-NO <sub>2</sub> -Ph)NH	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
106	(PhCH <sub>2</sub> )NH	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
107	[PhCH(Me)]NH	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
108	(PhCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> )NH	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
109	(PhCH <sub>2</sub> )(Me)N	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
110	[(4-Me-Ph)CH <sub>2</sub> ]NH	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
111	[(4-CF <sub>3</sub> -Ph)CH <sub>2</sub> ]NH	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
112	[(4-F-Ph)CH <sub>2</sub> ]NH	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
113	[(4-Cl-Ph)CH <sub>2</sub> ]NH	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
114	[(4-Br-Ph)CH <sub>2</sub> ]NH	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
115	[(4-MeO-Ph)CH <sub>2</sub> ]NH	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
116	[(4-CF <sub>3</sub> O-Ph)CH <sub>2</sub> ]NH	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
117	[(4-MeO-Ph)CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> ]NH	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
118	{[3,4-(MeO) <sub>2</sub> -Ph]CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> }NH	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
119	[(4-NO <sub>2</sub> -Ph)CH <sub>2</sub> ]NH	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
120	(Z3)NH	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
121	(Z5)NH	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
122	(4-Me-Z10)NH	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
123	(Z12)NH	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
124	(1-EtOOC-Piperidin-4-yl)NH	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
125	(2-Thiazolin-2-yl)NH	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl

(表 1 の続き)

化合物番号	R <sup>1</sup> R <sup>2</sup> N	Ar	R <sup>3</sup>
126	(1-Et-Pyrazol-5-yl)NH	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
127	(1,2,4-Triazol-3-yl)NH	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
128	(3-Me-Isoxazol-5-yl)NH	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
129	(5-Me-Isoxazol-3-yl)NH	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
130	(3-Me-Isythiazol-5-yl)NH	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
131	(Thiazol-2-yl)NH	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
132	(1,3,4-Thiadiazol-2-yl)NH	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
133	(Pyridin-2-yl)NH	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
134	(Pyridin-3-yl)NH	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
135	(Pyridin-4-yl)NH	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
136	(5-Me-Pyridin-2-yl)NH	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
137	(5-Cl-Pyridin-2-yl)NH	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
138	(5-Br-Pyridin-2-yl)NH	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
139	(6-MeO-Pyridin-3-yl)NH	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
140	(3-Cl-5-CF <sub>3</sub> -Pyridin-2-yl)NH	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
141	(5-NO <sub>2</sub> -Pyridin-2-yl)NH	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
142	(Pyrimidin-2-yl)NH	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
143	(Pyrimidin-4-yl)NH	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
144	(6-Cl-2-MeS-Pyrimidin-4-yl)NH	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
145	(Pyrazin-2-yl)NH	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
146	(1,2,4-Triazin-3-yl)NH	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
147	(NH <sub>2</sub> )NH	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
148	(Me <sub>2</sub> N)NH	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
149	(PhNH)NH	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
150	(MeNH)(Me)N	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl

(表 1 の続き)

化合物番号	$R^1R^2N$	Ar	$R^3$
151	(MeO)NH	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
152	(EtO)NH	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
153	(t-BuO)NH	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
154	(PhCH <sub>2</sub> O)NH	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
155	(MeO)(Me)N	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
156	NH <sub>2</sub>	2-Cl-6-F-Ph	Cl
157	MeNH	2-Cl-6-F-Ph	Cl
158	EtNH	2-Cl-6-F-Ph	Cl
159	i-PrNH	2-Cl-6-F-Ph	Cl
160	Me <sub>2</sub> N	2-Cl-6-F-Ph	Cl
161	Et <sub>2</sub> N	2-Cl-6-F-Ph	Cl
162	Pr <sub>2</sub> N	2-Cl-6-F-Ph	Cl
163	Bu <sub>2</sub> N	2-Cl-6-F-Ph	Cl
164	(i-Bu) <sub>2</sub> N	2-Cl-6-F-Ph	Cl
165	(CF <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> )NH	2-Cl-6-F-Ph	Cl
166	[CF <sub>3</sub> CH(Me)]NH	2-Cl-6-F-Ph	Cl
167	c-PentNH	2-Cl-6-F-Ph	Cl
168	c-HexNH	2-Cl-6-F-Ph	Cl
169	(c-Hex)(Me)N	2-Cl-6-F-Ph	Cl
170	(CH <sub>2</sub> =CHCH <sub>2</sub> )NH	2-Cl-6-F-Ph	Cl
171	(CH <sub>2</sub> =CHCH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> N	2-Cl-6-F-Ph	Cl
172	[CH <sub>2</sub> =C(Me)CH <sub>2</sub> ] <sub>2</sub> N	2-Cl-6-F-Ph	Cl
173	(CH≡CCH <sub>2</sub> )NH	2-Cl-6-F-Ph	Cl
174	(CH≡CCH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> N	2-Cl-6-F-Ph	Cl
175	Z3	2-Cl-6-F-Ph	Cl

(表 1 の続き)

化合物番号	R <sup>1</sup> R <sup>2</sup> N	Ar	R <sup>3</sup>
176	(2-Me-Z3)	2-Cl-6-F-Ph	Cl
177	(2,5-Me <sub>2</sub> -Z3)	2-Cl-6-F-Ph	Cl
178	Z4	2-Cl-6-F-Ph	Cl
179	Z5	2-Cl-6-F-Ph	Cl
180	(2-Me-Z5)	2-Cl-6-F-Ph	Cl
181	(3-Me-Z5)	2-Cl-6-F-Ph	Cl
182	(4-Me-Z5)	2-Cl-6-F-Ph	Cl
183	(3,3-Me <sub>2</sub> -Z5)	2-Cl-6-F-Ph	Cl
184	(3,5-Me <sub>2</sub> -Z5)	2-Cl-6-F-Ph	Cl
185	(2,6-Me <sub>2</sub> -Z5)	2-Cl-6-F-Ph	Cl
186	Z6	2-Cl-6-F-Ph	Cl
187	Z7	2-Cl-6-F-Ph	Cl
188	(2-Me-Z7)	2-Cl-6-F-Ph	Cl
189	Z8	2-Cl-6-F-Ph	Cl
190	(4-Me-Z10)	2-Cl-6-F-Ph	Cl
191	Z11	2-Cl-6-F-Ph	Cl
192	Z12	2-Cl-6-F-Ph	Cl
193	(2,6-Me <sub>2</sub> -Z12)	2-Cl-6-F-Ph	Cl
194	Z13	2-Cl-6-F-Ph	Cl
195	Z14	2-Cl-6-F-Ph	Cl
196	Z15	2-Cl-6-F-Ph	Cl
197	Z16	2-Cl-6-F-Ph	Cl
198	PhNH	2-Cl-6-F-Ph	Cl
199	(Ph)(Me)N	2-Cl-6-F-Ph	Cl
200	(PhCH <sub>2</sub> )NH	2-Cl-6-F-Ph	Cl

(表 1 の続き)

化合物番号	$R^1R^2N$	Ar	$R^3$
201	$(PhCH_2)(Me)N$	2-Cl-6-F-Ph	Cl
202	$NH_2$	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Cl
203	MeNH	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Cl
204	EtNH	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Cl
205	i-PrNH	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Cl
206	Me <sub>2</sub> N	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Cl
207	Et <sub>2</sub> N	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Cl
208	Pr <sub>2</sub> N	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Cl
209	Bu <sub>2</sub> N	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Cl
210	(i-Bu) <sub>2</sub> N	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Cl
211	$(CF_3CH_2)NH$	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Cl
212	$[CF_3CH(Me)]NH$	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Cl
213	c-PentNH	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Cl
214	c-HexNH	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Cl
215	$(c-Hex)(Me)N$	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Cl
216	$(CH_2=CHCH_2)NH$	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Cl
217	$(CH_2=CHCH_2)_2N$	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Cl
218	$[CH_2=C(Me)CH_2]_2N$	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Cl
219	$(CH\equiv CCH_2)NH$	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Cl
220	$(CH\equiv CCH_2)_2N$	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Cl
221	Z3	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Cl
222	(2-Me-Z3)	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Cl
223	(2,5-Me <sub>2</sub> -Z3)	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Cl
224	Z4	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Cl
225	Z5	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Cl

(表 1 の続き)

化合物番号	R <sup>1</sup> R <sup>2</sup> N	Ar	R <sup>3</sup>
226	(2-Me-Z5)	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Cl
227	(3-Me-Z5)	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Cl
228	(4-Me-Z5)	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Cl
229	(3,3-Me <sub>2</sub> -Z5)	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Cl
230	(3,5-Me <sub>2</sub> -Z5)	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Cl
231	(2,6-Me <sub>2</sub> -Z5)	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Cl
232	Z6	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Cl
233	Z7	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Cl
234	(2-Me-Z7)	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Cl
235	Z8	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Cl
236	(4-Me-Z10)	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Cl
237	Z11	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Cl
238	Z12	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Cl
239	(2,6-Me <sub>2</sub> -Z12)	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Cl
240	Z13	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Cl
241	Z14	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Cl
242	Z15	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Cl
243	Z16	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Cl
244	PhNH	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Cl
245	(Ph)(Me)N	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Cl
246	(PhCH <sub>2</sub> )NH	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Cl
247	(PhCH <sub>2</sub> )(Me)N	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Cl
248	Z5	Ph	Cl
249	(4-Me-Z5)	Ph	Cl
250	(2-Me-Z5)	Ph	Cl

(表 1 の続き)

化合物番号	R <sup>1</sup> R <sup>2</sup> N	Ar	R <sup>3</sup>
251	Z7	Ph	Cl
252	Z5	2-Cl-Ph	Cl
253	(4-Me-Z5)	2-Cl-Ph	Cl
254	(2-Me-Z5)	2-Cl-Ph	Cl
255	Z7	2-Cl-Ph	Cl
256	Z5	2-F-Ph	Cl
257	(4-Me-Z5)	2-F-Ph	Cl
258	(2-Me-Z5)	2-F-Ph	Cl
259	Z7	2-F-Ph	Cl
260	Z5	2-Me-Ph	Cl
261	(4-Me-Z5)	2-Me-Ph	Cl
262	(2-Me-Z5)	2-Me-Ph	Cl
263	Z7	2-Me-Ph	Cl
264	Z5	2-CF <sub>3</sub> -Ph	Cl
265	(4-Me-Z5)	2-CF <sub>3</sub> -Ph	Cl
266	(2-Me-Z5)	2-CF <sub>3</sub> -Ph	Cl
267	Z7	2-CF <sub>3</sub> -Ph	Cl
268	Z5	3-Cl-Ph	Cl
269	(4-Me-Z5)	3-Cl-Ph	Cl
270	(2-Me-Z5)	3-Cl-Ph	Cl
271	Z7	3-Cl-Ph	Cl
272	Z5	3-F-Ph	Cl
273	(4-Me-Z5)	3-F-Ph	Cl
274	(2-Me-Z5)	3-F-Ph	Cl
275	Z7	3-F-Ph	Cl

(表 1 の続き)

化合物番号	$R^1R^2N$	Ar	$R^3$
276	Z5	4-Cl-Ph	Cl
277	(4-Me-Z5)	4-Cl-Ph	Cl
278	(2-Me-Z5)	4-Cl-Ph	Cl
279	Z7	4-Cl-Ph	Cl
280	Z5	4-F-Ph	Cl
281	(4-Me-Z5)	4-F-Ph	Cl
282	(2-Me-Z5)	4-F-Ph	Cl
283	Z7	4-F-Ph	Cl
284	Z5	2,6-Cl <sub>2</sub> -Ph	Cl
285	(4-Me-Z5)	2,6-Cl <sub>2</sub> -Ph	Cl
286	(2-Me-Z5)	2,6-Cl <sub>2</sub> -Ph	Cl
287	Z7	2,6-Cl <sub>2</sub> -Ph	Cl
288	Z5	2,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	Cl
289	(4-Me-Z5)	2,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	Cl
290	(2-Me-Z5)	2,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	Cl
291	Z7	2,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	Cl
292	Z5	2,4-F <sub>2</sub> -Ph	Cl
293	(4-Me-Z5)	2,4-F <sub>2</sub> -Ph	Cl
294	(2-Me-Z5)	2,4-F <sub>2</sub> -Ph	Cl
295	Z7	2,4-F <sub>2</sub> -Ph	Cl
296	Z5	3,5-Cl <sub>2</sub> -Ph	Cl
297	(4-Me-Z5)	3,5-Cl <sub>2</sub> -Ph	Cl
298	(2-Me-Z5)	3,5-Cl <sub>2</sub> -Ph	Cl
299	Z7	3,5-Cl <sub>2</sub> -Ph	Cl
300	Z5	3,5-F <sub>2</sub> -Ph	Cl

(表 1 の続き)

化合物番号	R <sup>1</sup> R <sup>2</sup> N	Ar	R <sup>3</sup>
301	(4-Me-Z5)	3,5-F <sub>2</sub> -Ph	Cl
302	(2-Me-Z5)	3,5-F <sub>2</sub> -Ph	Cl
303	Z7	3,5-F <sub>2</sub> -Ph	Cl
304	Z5	2,4,6-Cl <sub>3</sub> -Ph	Cl
305	(4-Me-Z5)	2,4,6-Cl <sub>3</sub> -Ph	Cl
306	(2-Me-Z5)	2,4,6-Cl <sub>3</sub> -Ph	Cl
307	Z7	2,4,6-Cl <sub>3</sub> -Ph	Cl
308	Z5	2,6-Cl <sub>2</sub> -4-F-Ph	Cl
309	(4-Me-Z5)	2,6-Cl <sub>2</sub> -4-F-Ph	Cl
310	(2-Me-Z5)	2,6-Cl <sub>2</sub> -4-F-Ph	Cl
311	Z7	2,6-Cl <sub>2</sub> -4-F-Ph	Cl
312	Z5	2,4-Cl <sub>2</sub> -6-F-Ph	Cl
313	(4-Me-Z5)	2,4-Cl <sub>2</sub> -6-F-Ph	Cl
314	(2-Me-Z5)	2,4-Cl <sub>2</sub> -6-F-Ph	Cl
315	Z7	2,4-Cl <sub>2</sub> -6-F-Ph	Cl
316	Z5	2-Cl-4,6-F <sub>2</sub> -Ph	Cl
317	(4-Me-Z5)	2-Cl-4,6-F <sub>2</sub> -Ph	Cl
318	(2-Me-Z5)	2-Cl-4,6-F <sub>2</sub> -Ph	Cl
319	Z7	2-Cl-4,6-F <sub>2</sub> -Ph	Cl
320	Z5	4-Cl-2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Cl
321	(4-Me-Z5)	4-Cl-2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Cl
322	(2-Me-Z5)	4-Cl-2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Cl
323	Z7	4-Cl-2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Cl
324	Z5	2,6-F <sub>2</sub> -4-(MeO)-Ph	Cl
325	(4-Me-Z5)	2,6-F <sub>2</sub> -4-(MeO)-Ph	Cl

(表 1 の続き)

化合物番号	R <sup>1</sup> R <sup>2</sup> N	Ar	R <sup>3</sup>
326	(2-Me-Z5)	2,6-F <sub>2</sub> -4-(MeO)-Ph	Cl
327	Z7	2,6-F <sub>2</sub> -4-(MeO)-Ph	Cl
328	Z5	2,3,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
329	(4-Me-Z5)	2,3,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
330	(2-Me-Z5)	2,3,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
331	Z7	2,3,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
332	Z5	2,3,4,5,6-F <sub>5</sub> -Ph	Cl
333	(4-Me-Z5)	2,3,4,5,6-F <sub>5</sub> -Ph	Cl
334	(2-Me-Z5)	2,3,4,5,6-F <sub>5</sub> -Ph	Cl
335	Z7	2,3,4,5,6-F <sub>5</sub> -Ph	Cl
336	Z5	3-F-6-CF <sub>3</sub> -Ph	Cl
337	(4-Me-Z5)	3-F-6-CF <sub>3</sub> -Ph	Cl
338	(2-Me-Z5)	3-F-6-CF <sub>3</sub> -Ph	Cl
339	Z7	3-F-6-CF <sub>3</sub> -Ph	Cl
340	Z5	2,4,6-Me <sub>3</sub> -Ph	Cl
341	(4-Me-Z5)	2,4,6-Me <sub>3</sub> -Ph	Cl
342	(2-Me-Z5)	2,4,6-Me <sub>3</sub> -Ph	Cl
343	Z7	2,4,6-Me <sub>3</sub> -Ph	Cl
344	NH <sub>2</sub>	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Me
345	MeNH	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Me
346	EtNH	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Me
347	i-PrNH	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Me
348	Me <sub>2</sub> N	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Me
349	Et <sub>2</sub> N	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Me
350	Pr <sub>2</sub> N	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Me

(表 1 の続き)

化合物番号	$R^1R^2N$	Ar	$R^3$
351	$Bu_2N$	2,4,6- $F_3$ -Ph	Me
352	$(i-Bu)_2N$	2,4,6- $F_3$ -Ph	Me
353	$(CF_3CH_2)NH$	2,4,6- $F_3$ -Ph	Me
354	$[CF_3CH(Me)]NH$	2,4,6- $F_3$ -Ph	Me
355	c-PentNH	2,4,6- $F_3$ -Ph	Me
356	c-HexNH	2,4,6- $F_3$ -Ph	Me
357	$(c-Hex)(Me)N$	2,4,6- $F_3$ -Ph	Me
358	$(CH_2=CHCH_2)NH$	2,4,6- $F_3$ -Ph	Me
359	$(CH_2=CHCH_2)_2N$	2,4,6- $F_3$ -Ph	Me
360	$[CH_2=C(Me)CH_2]_2N$	2,4,6- $F_3$ -Ph	Me
361	$(CH\equiv CCH_2)NH$	2,4,6- $F_3$ -Ph	Me
362	$(CH\equiv CCH_2)_2N$	2,4,6- $F_3$ -Ph	Me
363	Z3	2,4,6- $F_3$ -Ph	Me
364	(2-Me-Z3)	2,4,6- $F_3$ -Ph	Me
365	(2,5-Me <sub>2</sub> -Z3)	2,4,6- $F_3$ -Ph	Me
366	Z4	2,4,6- $F_3$ -Ph	Me
367	Z5	2,4,6- $F_3$ -Ph	Me
368	(2-Me-Z5)	2,4,6- $F_3$ -Ph	Me
369	(3-Me-Z5)	2,4,6- $F_3$ -Ph	Me
370	(4-Me-Z5)	2,4,6- $F_3$ -Ph	Me
371	(3,3-Me <sub>2</sub> -Z5)	2,4,6- $F_3$ -Ph	Me
372	(3,5-Me <sub>2</sub> -Z5)	2,4,6- $F_3$ -Ph	Me
373	(2,6-Me <sub>2</sub> -Z5)	2,4,6- $F_3$ -Ph	Me
374	Z6	2,4,6- $F_3$ -Ph	Me
375	Z7	2,4,6- $F_3$ -Ph	Me

(表 1 の続き)

化合物番号	$R^1R^2N$	Ar	$R^3$
376	(2-Me-Z7)	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Me
377	Z8	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Me
378	(4-Me-Z10)	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Me
379	Z11	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Me
380	Z12	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Me
381	(2,6-Me <sub>2</sub> -Z12)	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Me
382	Z13	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Me
383	Z14	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Me
384	Z15	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Me
385	Z16	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Me
386	PhNH	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Me
387	(Ph)(Me)N	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Me
388	(PhCH <sub>2</sub> )NH	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Me
389	(PhCH <sub>2</sub> )(Me)N	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Me
390	Z5	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Et
391	(4-Me-Z5)	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Et
392	(2-Me-Z5)	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Et
393	Z7	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Et
394	Z5	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Pr
395	(4-Me-Z5)	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Pr
396	(2-Me-Z5)	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Pr
397	Z7	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Pr
398	Z5	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	i-Pr
399	(4-Me-Z5)	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	i-Pr
400	(2-Me-Z5)	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	i-Pr

(表1の続き)

化合物番号	$R^1R^2N$	Ar	$R^3$
401	Z7	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	i-Pr
402	NH <sub>2</sub>	2-Cl-6-F-Ph	Me
403	MeNH	2-Cl-6-F-Ph	Me
404	EtNH	2-Cl-6-F-Ph	Me
405	i-PrNH	2-Cl-6-F-Ph	Me
406	Me <sub>2</sub> N	2-Cl-6-F-Ph	Me
407	Et <sub>2</sub> N	2-Cl-6-F-Ph	Me
408	Pr <sub>2</sub> N	2-Cl-6-F-Ph	Me
409	Bu <sub>2</sub> N	2-Cl-6-F-Ph	Me
410	(i-Bu) <sub>2</sub> N	2-Cl-6-F-Ph	Me
411	(CF <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> )NH	2-Cl-6-F-Ph	Me
412	[CF <sub>3</sub> CH(Me)]NH	2-Cl-6-F-Ph	Me
413	c-PentNH	2-Cl-6-F-Ph	Me
414	c-HexNH	2-Cl-6-F-Ph	Me
415	(c-Hex)(Me)N	2-Cl-6-F-Ph	Me
416	(CH <sub>2</sub> =CHCH <sub>2</sub> )NH	2-Cl-6-F-Ph	Me
417	(CH <sub>2</sub> =CHCH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> N	2-Cl-6-F-Ph	Me
418	[CH <sub>2</sub> =C(Me)CH <sub>2</sub> ] <sub>2</sub> N	2-Cl-6-F-Ph	Me
419	(CH≡CCH <sub>2</sub> )NH	2-Cl-6-F-Ph	Me
420	(CH≡CCH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> N	2-Cl-6-F-Ph	Me
421	Z3	2-Cl-6-F-Ph	Me
422	(2-Me-Z3)	2-Cl-6-F-Ph	Me
423	(2,5-Me <sub>2</sub> -Z3)	2-Cl-6-F-Ph	Me
424	Z4	2-Cl-6-F-Ph	Me
425	Z5	2-Cl-6-F-Ph	Me

(表 1 の続き)

化合物番号	R <sup>1</sup> R <sup>2</sup> N	Ar	R <sup>3</sup>
426	(2-Me-Z5)	2-Cl-6-F-Ph	Me
427	(3-Me-Z5)	2-Cl-6-F-Ph	Me
428	(4-Me-Z5)	2-Cl-6-F-Ph	Me
429	(3,3-Me <sub>2</sub> -Z5)	2-Cl-6-F-Ph	Me
430	(3,5-Me <sub>2</sub> -Z5)	2-Cl-6-F-Ph	Me
431	(2,6-Me <sub>2</sub> -Z5)	2-Cl-6-F-Ph	Me
432	Z6	2-Cl-6-F-Ph	Me
433	Z7	2-Cl-6-F-Ph	Me
434	(2-Me-Z7)	2-Cl-6-F-Ph	Me
435	Z8	2-Cl-6-F-Ph	Me
436	(4-Me-Z10)	2-Cl-6-F-Ph	Me
437	Z11	2-Cl-6-F-Ph	Me
438	Z12	2-Cl-6-F-Ph	Me
439	(2,6-Me <sub>2</sub> -Z12)	2-Cl-6-F-Ph	Me
440	Z13	2-Cl-6-F-Ph	Me
441	Z14	2-Cl-6-F-Ph	Me
442	Z15	2-Cl-6-F-Ph	Me
443	Z16	2-Cl-6-F-Ph	Me
444	PhNH	2-Cl-6-F-Ph	Me
445	(Ph)(Me)N	2-Cl-6-F-Ph	Me
446	(PhCH <sub>2</sub> )NH	2-Cl-6-F-Ph	Me
447	(PhCH <sub>2</sub> )(Me)N	2-Cl-6-F-Ph	Me
448	Z5	2-Cl-6-F-Ph	Et
449	(4-Me-Z5)	2-Cl-6-F-Ph	Et
450	(2-Me-Z5)	2-Cl-6-F-Ph	Et

(表 1 の続き)

化合物番号	$R^1R^2N$	Ar	$R^3$
451	Z7	2-Cl-6-F-Ph	Et
452	Z5	2-Cl-6-F-Ph	Pr
453	(4-Me-Z5)	2-Cl-6-F-Ph	Pr
454	(2-Me-Z5)	2-Cl-6-F-Ph	Pr
455	Z7	2-Cl-6-F-Ph	Pr
456	Z5	2-Cl-6-F-Ph	i-Pr
457	(4-Me-Z5)	2-Cl-6-F-Ph	i-Pr
458	(2-Me-Z5)	2-Cl-6-F-Ph	i-Pr
459	Z7	2-Cl-6-F-Ph	i-Pr
460	$NH_2$	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Me
461	MeNH	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Me
462	EtNH	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Me
463	i-PrNH	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Me
464	Me <sub>2</sub> N	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Me
465	Et <sub>2</sub> N	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Me
466	Pr <sub>2</sub> N	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Me
467	Bu <sub>2</sub> N	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Me
468	(i-Bu) <sub>2</sub> N	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Me
469	(CF <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> )NH	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Me
470	[CF <sub>3</sub> CH(Me)]NH	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Me
471	c-PentNH	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Me
472	c-HexNH	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Me
473	(c-Hex)(Me)N	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Me
474	(CH <sub>2</sub> =CHCH <sub>2</sub> )NH	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Me
475	(CH <sub>2</sub> =CHCH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> N	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Me

(表 1 の続き)

化合物番号	$R^1R^2N$	Ar	$R^3$
476	$[CH_2=C(Me)CH_2]_2N$	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Me
477	$(CH\equiv CCH_2)NH$	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Me
478	$(CH\equiv CCH_2)_2N$	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Me
479	Z3	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Me
480	(2-Me-Z3)	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Me
481	(2,5-Me <sub>2</sub> -Z3)	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Me
482	Z4	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Me
483	Z5	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Me
484	(2-Me-Z5)	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Me
485	(3-Me-Z5)	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Me
486	(4-Me-Z5)	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Me
487	(3,3-Me <sub>2</sub> -Z5)	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Me
488	(3,5-Me <sub>2</sub> -Z5)	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Me
489	(2,6-Me <sub>2</sub> -Z5)	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Me
490	Z6	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Me
491	Z7	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Me
492	(2-Me-Z7)	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Me
493	Z8	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Me
494	(4-Me-Z10)	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Me
495	Z11	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Me
496	Z12	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Me
497	(2,6-Me <sub>2</sub> -Z12)	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Me
498	Z13	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Me
499	Z14	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Me
500	Z15	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Me

(表 1 の続き)

化合物番号	$R^1R^2N$	Ar	$R^3$
501	Z16	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Me
502	PhNH	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Me
503	(Ph)(Me)N	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Me
504	(PhCH <sub>2</sub> )NH	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Me
505	(PhCH <sub>2</sub> )(Me)N	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Me
506	Z5	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Et
507	(4-Me-Z5)	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Et
508	(2-Me-Z5)	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Et
509	Z7	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Et
510	Z5	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Pr
511	(4-Me-Z5)	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Pr
512	(2-Me-Z5)	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Pr
513	Z7	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Pr
514	Z5	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	i-Pr
515	(4-Me-Z5)	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	i-Pr
516	(2-Me-Z5)	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	i-Pr
517	Z7	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	i-Pr
518	Z17	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
519	Z18	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
520	Z19	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
521	Z20	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
522	Z21	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
523	Z22	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
524	Z23	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
525	Z24	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl

(表 1 の続き)

化合物番号	$R^1R^2N$	Ar	$R^3$
526	Z25	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
527	Z26	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
528	Z27	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
529	Z28	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
530	Z29	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
531	Z30	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
532	Z31	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
533	(Et)(Me)N	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
534	(Pr)(Me)N	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
535	(Bu)(Me)N	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
536	(CH <sub>2</sub> =CHCH <sub>2</sub> )(Me)N	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
537	(CH≡CHCH <sub>2</sub> )(Me)N	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl
538	Z17	2-Cl-6-F-Ph	Cl
539	Z18	2-Cl-6-F-Ph	Cl
540	Z19	2-Cl-6-F-Ph	Cl
541	Z20	2-Cl-6-F-Ph	Cl
542	Z21	2-Cl-6-F-Ph	Cl
543	Z22	2-Cl-6-F-Ph	Cl
544	Z23	2-Cl-6-F-Ph	Cl
545	Z24	2-Cl-6-F-Ph	Cl
546	Z25	2-Cl-6-F-Ph	Cl
547	Z26	2-Cl-6-F-Ph	Cl
548	Z27	2-Cl-6-F-Ph	Cl
549	Z28	2-Cl-6-F-Ph	Cl
550	Z29	2-Cl-6-F-Ph	Cl

(表 1 の続き)

化合物番号	R <sup>1</sup> R <sup>2</sup> N	Ar	R <sup>3</sup>
551	Z30	2-Cl-6-F-Ph	Cl
552	Z31	2-Cl-6-F-Ph	Cl
553	(Et)(Me)N	2-Cl-6-F-Ph	Cl
554	(Pr)(Me)N	2-Cl-6-F-Ph	Cl
555	(Bu)(Me)N	2-Cl-6-F-Ph	Cl
556	(CH <sub>2</sub> =CHCH <sub>2</sub> )(Me)N	2-Cl-6-F-Ph	Cl
557	(CH≡CHCH <sub>2</sub> )(Me)N	2-Cl-6-F-Ph	Cl
558	Z17	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Cl
559	Z18	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Cl
560	Z19	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Cl
561	Z20	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Cl
562	Z21	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Cl
563	Z22	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Cl
564	Z23	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Cl
565	Z24	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Cl
566	Z25	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Cl
567	Z26	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Cl
568	Z27	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Cl
569	Z28	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Cl
570	Z29	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Cl
571	Z30	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Cl
572	Z31	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Cl
573	(Et)(Me)N	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Cl
574	(Pr)(Me)N	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Cl
575	(Bu)(Me)N	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Cl

(表 1 の続き)

化合物番号	$R^1R^2N$	Ar	$R^3$
576	$(CH_2=CHCH_2)(Me)N$	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Cl
577	$(CH\equiv CHCH_2)(Me)N$	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Cl
578	Z17	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Me
579	Z18	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Me
580	Z19	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Me
581	Z20	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Me
582	Z21	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Me
583	Z22	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Me
584	Z23	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Me
585	Z24	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Me
586	Z25	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Me
587	Z26	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Me
588	Z27	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Me
589	Z28	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Me
590	Z29	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Me
591	Z30	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Me
592	Z31	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Me
593	(Et)(Me)N	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Me
594	(Pr)(Me)N	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Me
595	(Bu)(Me)N	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Me
596	$(CH_2=CHCH_2)(Me)N$	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Me
597	$(CH\equiv CHCH_2)(Me)N$	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Me
598	Z17	2-Cl-6-F-Ph	Me
599	Z18	2-Cl-6-F-Ph	Me
600	Z19	2-Cl-6-F-Ph	Me

(表 1 の続き)

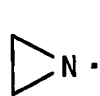
化合物番号	$R^1R^2N$	Ar	$R^3$
601	Z20	2-Cl-6-F-Ph	Me
602	Z21	2-Cl-6-F-Ph	Me
603	Z22	2-Cl-6-F-Ph	Me
604	Z23	2-Cl-6-F-Ph	Me
605	Z24	2-Cl-6-F-Ph	Me
606	Z25	2-Cl-6-F-Ph	Me
607	Z26	2-Cl-6-F-Ph	Me
608	Z27	2-Cl-6-F-Ph	Me
609	Z28	2-Cl-6-F-Ph	Me
610	Z29	2-Cl-6-F-Ph	Me
611	Z30	2-Cl-6-F-Ph	Me
612	Z31	2-Cl-6-F-Ph	Me
613	(Et)(Me)N	2-Cl-6-F-Ph	Me
614	(Pr)(Me)N	2-Cl-6-F-Ph	Me
615	(Bu)(Me)N	2-Cl-6-F-Ph	Me
616	$(CH_2=CHCH_2)(Me)N$	2-Cl-6-F-Ph	Me
617	$(CH\equiv CHCH_2)(Me)N$	2-Cl-6-F-Ph	Me
618	Z17	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Me
619	Z18	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Me
620	Z19	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Me
621	Z20	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Me
622	Z21	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Me
623	Z22	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Me
624	Z23	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Me
625	Z24	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Me

(表 1 の続き)

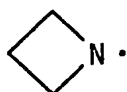
化合物番号	R <sup>1</sup> R <sup>2</sup> N	Ar	R <sup>3</sup>
626	Z25	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Me
627	Z26	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Me
628	Z27	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Me
629	Z28	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Me
630	Z29	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Me
631	Z30	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Me
632	Z31	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Me
633	(Et)(Me)N	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Me
634	(Pr)(Me)N	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Me
635	(Bu)(Me)N	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Me
636	(CH <sub>2</sub> =CHCH <sub>2</sub> )(Me)N	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Me
637	(CH≡CHCH <sub>2</sub> )(Me)N	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Me

尚、上表において、Me はメチル基を、Et はエチル基を、i-Pr はイソプロピル基を、Bu はブチル基を、t-Bu は tert-ブチル基を、i-Bu はイソブチル基を、c-Pr  
5 はシクロプロピル基を、c-Bu はシクロブチル基を、c-Pent はシクロペンチル基を、  
c-Hex はシクロヘキシル基を、c-Hep はシクロヘプチル基を、c-Oct はシクロオク  
チル基を、Ac はアセチル基を、Ph はフェニル基を、Cyano はシアノ基を表す。

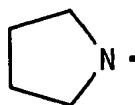
また、Z1、Z2、Z3、Z4、Z5、Z6、Z7、Z8、Z9、Z10、Z11、Z12、Z13、Z14、Z15、  
Z16、Z17、Z18、Z19、Z20、Z21、Z22、Z23、Z24、Z25、Z26、Z27、Z28、Z29、Z30  
10 および Z31 は以下の構造を有する基である。



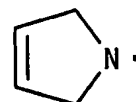
(Z1)



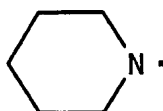
(Z2)



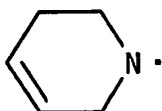
(Z3)



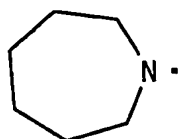
(Z4)



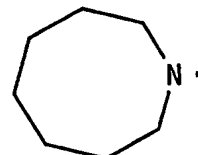
(Z5)



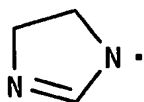
(Z6)



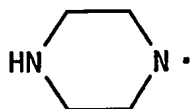
(Z7)



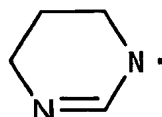
(Z8)



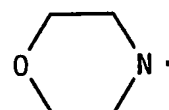
(Z9)



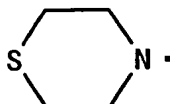
(Z10)



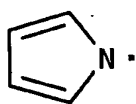
(Z11)



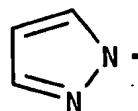
(Z12)



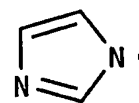
(Z13)



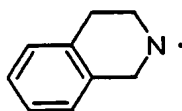
(Z14)



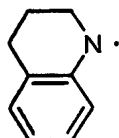
(Z15)



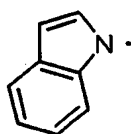
(Z16)



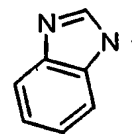
(Z17)



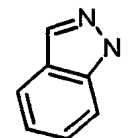
(Z18)



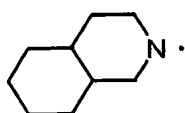
(Z19)



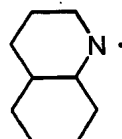
(Z20)



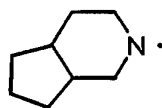
(Z21)



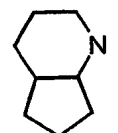
(Z22)



(Z23)



(Z24)



(Z25)



(Z26)



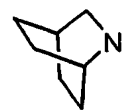
(Z27)



(Z28)



(Z29)



(Z30)



(Z31)

本発明化合物のいくつかについて、その物性値を示す。

化合物 1

$^1\text{H-NMR}$   $\delta$  (ppm; TMS) : (DMSO- $d_6$ ) 7.38 (2H, dd,  $J=7.6, 9.2$ ), 7.58 (1H, d,  $J=1.6$ ), 7.93 (2H, brs), 7.98 (1H, d,  $J=1.6$ )

5 化合物 4

$^1\text{H-NMR}$   $\delta$  (ppm; TMS) : ( $\text{CDCl}_3$ ) 1.21 (6H, d,  $J=6.4\text{Hz}$ ), 3.6-3.8 (1H, m), 5.19 (1H, brs), 6.86 (2H, t,  $J=8.5\text{Hz}$ ), 7.71 (1H, d,  $J=1\text{Hz}$ ), 7.89 (1H, d,  $J=1\text{Hz}$ )

化合物 7

融点 : 137.8 $^{\circ}\text{C}$

10  $^1\text{H-NMR}$   $\delta$  (ppm; TMS) : ( $\text{CDCl}_3$ ) 1.10 (6H, t,  $J=7.1\text{Hz}$ ), 3.11 (4H, q,  $J=7.1\text{Hz}$ ), 6.8-6.9 (2H, m), 7.47 (1H, d,  $J=1.4\text{Hz}$ ), 7.76 (1H, d,  $J=1.4\text{Hz}$ )

化合物 8

融点 : 95.4 $^{\circ}\text{C}$

15  $^1\text{H-NMR}$   $\delta$  (ppm; TMS) : ( $\text{CDCl}_3$ ) 0.83 (6H, t,  $J=7\text{Hz}$ ), 1.4-1.6 (4H, m), 2.9-3.0 (4H, m), 6.84 (2H, dd,  $J=7.1\text{Hz}, 8.5\text{Hz}$ ), 7.48 (1H, d,  $J=1.3\text{Hz}$ ), 7.76 (1H, d,  $J=1.3\text{Hz}$ )

化合物 9

20  $^1\text{H-NMR}$   $\delta$  (ppm; TMS) : ( $\text{CDCl}_3$ ) 0.86 (6H, t,  $J=7.4\text{Hz}$ ), 1.1-1.3 (4H, m), 1.4-1.5 (4H, m), 2.9-3.0 (4H, m), 6.84 (2H, dd,  $J=7.1\text{Hz}, 8.6\text{Hz}$ ), 7.46 (1H, d,  $J=1.4\text{Hz}$ ), 7.74 (1H, d,  $J=1.4\text{Hz}$ )

化合物 20

$^1\text{H-NMR}$   $\delta$  (ppm; TMS) : ( $\text{CDCl}_3$ ) 1.0-2.0 (10H, m), 3.28 (1H, brs), 5.23 (1H, brs), 6.87 (2H, dd,  $J=6.9\text{Hz}, 8.5\text{Hz}$ ), 7.70 (1H, d,  $J=1\text{Hz}$ ), 7.83 (1H, d,  $J=1\text{Hz}$ )

25 化合物 21

$^1\text{H-NMR}$   $\delta$  (ppm; TMS) : ( $\text{CDCl}_3$ ) 0.9-1.3 (3H, m), 1.4-1.7 (6H, m), 2.72 (3H, s), 3.0-3.2 (1H, m), 6.8-6.9 (2H, m), 7.41 (1H, d,  $J=1\text{Hz}$ ), 7.76 (1H, d,  $J=1\text{Hz}$ )

化合物 29

$^1\text{H-NMR}$   $\delta$  (ppm; TMS): ( $\text{CDCl}_3$ ) 3.62 (4H, d,  $J=6.0\text{Hz}$ ), 5.1-5.3 (4H, m), 5.5-5.7 (2H, m), 6.85 (2H, dd,  $J=7.0\text{Hz}, 8.5\text{Hz}$ ), 7.51 (1H, d,  $J=1.4\text{Hz}$ ), 7.76 (1H, d,  $J=1.4\text{Hz}$ )

## 化合物 4 8

5  $^1\text{H-NMR}$   $\delta$  (ppm; TMS): ( $\text{CDCl}_3$ ) 1.8-2.0 (4H, m), 3.2-3.3 (4H, m), 6.81 (2H, dd,  $J=7.0\text{Hz}, 8.4\text{Hz}$ ), 7.53 (1H, d,  $J=1.4\text{Hz}$ ), 7.69 (1H, d,  $J=1.7\text{Hz}$ )

## 化合物 4 9

$^1\text{H-NMR}$   $\delta$  (ppm; TMS): ( $\text{CDCl}_3$ ) 0.98 (3H, d,  $J=6.0\text{Hz}$ ), 1.4-1.6 (1H, m), 1.7-1.9 (1H, m), 1.9-2.2 (2H, m), 3.1-3.3 (1H, m), 3.4-3.6 (2H, m), 6.7-6.9 (2H, m), 7.51 (1H, d,  $J=1.4\text{Hz}$ ), 7.71 (1H, d,  $J=1.7\text{Hz}$ )

10

## 化合物 5 0

$^1\text{H-NMR}$   $\delta$  (ppm; TMS): ( $\text{CDCl}_3$ ) 1.05 (6H, d,  $J=6.3\text{Hz}$ ), 1.5-1.7 (2H, m), 1.7-1.9 (2H, m), 3.2-3.4 (2H, m), 6.8-6.9 (2H, m), 7.72 (1H, d,  $J=1.4\text{Hz}$ ), 7.92 (1H, d,  $J=1.4\text{Hz}$ )

15 化合物 5 2

融点: 174.4 $^{\circ}\text{C}$

$^1\text{H-NMR}$   $\delta$  (ppm; TMS): ( $\text{CDCl}_3$ ) 1.61 (6H, brs), 2.92 (4H, brs), 6.8-6.9 (2H, m), 7.39 (1H, s), 7.74 (1H, s)

## 化合物 5 3

20  $^1\text{H-NMR}$   $\delta$  (ppm; TMS): ( $\text{CDCl}_3$ ) 1.03 (3H, d,  $J=6.5\text{Hz}$ ), 1.2-1.8 (6H, m), 2.97-3.4 (3H, m), 6.8-6.9 (2H, m), 7.53 (1H, br), 7.74 (1H, d,  $J=1.4\text{Hz}$ )

## 化合物 5 4

$^1\text{H-NMR}$   $\delta$  (ppm; TMS): ( $\text{CDCl}_3$ ) 0.86 (3H, d,  $J=6.63\text{Hz}$ ), 1.1-1.3 (2H, m), 1.4-1.6 (1H, m), 1.6-1.7 (2H, m), 2.5-2.7 (2H, m), 3.2-3.4 (2H, m), 7.04 (2H, dd,  $J=7.3\text{Hz}, 8.5\text{Hz}$ ), 7.40 (1H, d,  $J=1.2\text{Hz}$ ), 7.74 (1H, d,  $J=1.4\text{Hz}$ )

25

## 化合物 5 5

融点: 200.8 $^{\circ}\text{C}$

$^1\text{H-NMR}$   $\delta$  (ppm; TMS): ( $\text{CDCl}_3$ ) 0.99 (3H, d,  $J=6.4\text{Hz}$ ), 1.1-1.4 (2H, m), 1.4-1.6 (1H, m), 1.6-1.8 (2H, m), 2.5-2.7 (2H, m), 3.2-3.4 (2H, m), 6.85

(2H, dd,  $J=7.1\text{Hz}, 8.4\text{Hz}$ ), 7.40 (1H, d,  $J=1.7\text{Hz}$ ), 7.77 (1H, d,  $J=1.7\text{Hz}$ )

化合物 6 3

$^1\text{H-NMR}$   $\delta$  (ppm; TMS): ( $\text{CDCl}_3$ ) 0.6-0.8 (2H, m), 0.82 (6H, d,  $J=6.6\text{Hz}$ ),  
1.7-1.9 (2H, m), 2.0-2.3 (2H, m), 3.2-3.3 (2H, m), 6.85 (2H, dd,  
5  $J=7.2\text{Hz}, 8.3\text{Hz}$ ), 7.37 (1H, d,  $J=1\text{Hz}$ ), 7.74 (1H, d,  $J=1\text{Hz}$ )

化合物 6 5

$^1\text{H-NMR}$   $\delta$  (ppm; TMS): ( $\text{CDCl}_3$ ) 0.72 (3H, t,  $J=7.2\text{Hz}$ ), 1.0-1.8 (8H,  
m), 3.0-3.4 (3H, m), 6.8-6.9 (2H, m), 7.48 (1H, brs), 7.73 (1H, d,  $J=1.4\text{Hz}$ )

化合物 6 7

10  $^1\text{H-NMR}$   $\delta$  (ppm; TMS): ( $\text{CDCl}_3$ ) 1.4-1.9 (2H, m), 1.9-2.0 (2H, m),  
2.6-3.0 (2H, m), 3.1-3.4 (2H, m), 3.7-4.1 (1H, m), 6.85, (1H, dd,  $J=7.0\text{Hz},$   
8.2Hz), 7.39 (1H, d,  $J=1.4\text{Hz}$ ), 7.76 (1H, d,  $J=1.4\text{Hz}$ )

化合物 7 1

$^1\text{H-NMR}$   $\delta$  (ppm; TMS): ( $\text{CDCl}_3$ ) 2.1-2.4 (2H, m), 3.0-3.3 (2H, m),  
15 3.4-3.7 (2H, m), 5.6-5.7 (1H, m), 5.8-5.9 (1H, m), 6.8-6.9 (2H, m), 7.41 (1H,  
d,  $J=1.4\text{Hz}$ ), 7.75 (1H, d,  $J=1.4\text{Hz}$ )

化合物 7 2

融点: 143.8°C

$^1\text{H-NMR}$   $\delta$  (ppm; TMS): ( $\text{CDCl}_3$ ) 1.6-1.8 (8H, m), 3.1-3.2 (4H, m), 6.85  
20 (2H, dd,  $J=6.8\text{Hz}, 8.6\text{Hz}$ ), 7.52 (1H, d,  $J=1\text{Hz}$ ), 7.75 (1H, d,  $J=1\text{Hz}$ )

化合物 7 3

$^1\text{H-NMR}$   $\delta$  (ppm; TMS): ( $\text{CDCl}_3$ ) 1.5-1.7 (10H, m), 3.1-3.2 (4H, m),  
6.8-6.9 (2H, m), 7.58 (1H, d,  $J=1\text{Hz}$ ), 7.77 (1H, d,  $J=1\text{Hz}$ )

化合物 7 6

25  $^1\text{H-NMR}$   $\delta$  (ppm; TMS): ( $\text{CDCl}_3$ ) 2.38 (3H, s), 2.57 (4H, brs), 3.07 (4H,  
brs), 6.85 (2H, dd,  $J=7.1\text{Hz}, 8.4\text{Hz}$ ), 7.44 (1H, d,  $J=1\text{Hz}$ ), 7.77 (1H, d,  $J=1\text{Hz}$ )

化合物 8 1

融点: 185.4°C

$^1\text{H-NMR}$   $\delta$  (ppm; TMS): ( $\text{CDCl}_3$ ) 3.01 (4H, brs), 3.77 (4H, t,  $J=4.6$ ),

6.88 (2H, dd, J=7.1Hz,8.5Hz), 7.45 (1H, d, J=1.4Hz), 7.79 (1H, d, J=1.4Hz)

化合物 8 3

融点 : 2 0 1 . 7 °C

<sup>1</sup>H-NMR δ (ppm; TMS) : (CDCl<sub>3</sub>) 2.68 (4H, brs), 3.23 (4H, brs), 6.8-6.9  
5 (2H, m), 7.45 (1H, d, J=1.4Hz), 7.80 (1H, d, J=1.4Hz)

化合物 8 5

<sup>1</sup>H-NMR δ (ppm; TMS) : (CDCl<sub>3</sub>) 6.44 (1H, t, J=2.4Hz), 6.76 (2H, dd, J=7.1Hz,8.5Hz), 7.43 (1H, d, J=2.6Hz), 7.72 (1H, d, J=1.6Hz), 7.85 (1H, d, J=2.6Hz), 7.86 (1H, d, J=1.6Hz)

10 化合物 8 9

融点 : 1 5 0 . 4 °C

<sup>1</sup>H-NMR δ (ppm; TMS) : (CDCl<sub>3</sub>) 1.94 (3H, s), 2.20 (3H, s), 5.98 (1H, s), 6.7-6.8 (2H, m), 7.19 (1H, d, J=1.6Hz), 7.84 (1H, d, J=1.6Hz)

化合物 9 0

15 <sup>1</sup>H-NMR δ (ppm; TMS) : (CDCl<sub>3</sub>) 6.73 (2H, t, J=7.8Hz), 7.02 (1H, d, J=1.4Hz), 7.12 (1H, s), 7.92 (1H, d, J=1.4Hz)

化合物 1 0 6

<sup>1</sup>H-NMR δ (ppm; TMS) : (DMSO-d<sub>6</sub>) 4.28 (2H, d, J=6.6Hz), 6.8-7.0 (2H, m), 7.07 (2H, dd, J=7.5Hz,9.1Hz), 7.68 (1H, d, J=1.5Hz), 8.19 (1H, d, J=1.5Hz),  
20 8.4-8.5 (1H, d, m)

化合物 1 0 9

<sup>1</sup>H-NMR δ (ppm; TMS) : (CDCl<sub>3</sub>) 2.69 (3H, s), 3.97 (2H, s), 6.87 (2H, dd, J=7.3Hz,8.4Hz), 7.2-7.3 (2H, m), 7.3-7.4 (3H, m), 7.48 (1H, d, J=1Hz), 7.75 (1H, s)

25 化合物 1 5 9

<sup>1</sup>H-NMR δ (ppm; TMS) : (CDCl<sub>3</sub>) 1.17 (6H, t, J=5.5Hz), 3.6-3.8 (1H, m), 4.74 (1H, brd, J=8.7), 7.1-7.2 (m, 1H), 7.3-7.5 (2H, m), 7.72 (2H, s)

化合物 1 6 1

<sup>1</sup>H-NMR δ (ppm; TMS) : (CDCl<sub>3</sub>) 1.10 (6H, t, J=7.1Hz), 3.0-3.2 (4H,

m), 7.1-7.2 (1H, m), 7.3-7.5 (2H, m), 7.47 (1H, d, J=1.4Hz), 7.76 (1H, d, J=1.4Hz)

化合物 1 7 5

<sup>1</sup>H-NMR δ (ppm; TMS): (CDCl<sub>3</sub>) 1.8-1.9 (4H, m), 3.2-3.3 (4H, m),  
5 7.1-7.2 (m, 1H), 7.3-7.5 (m, 2H), 7.58 (1H, d, J=1.5Hz), 7.71 (1H, d, J=1.5Hz)

化合物 1 8 0

<sup>1</sup>H-NMR δ (ppm; TMS): (CDCl<sub>3</sub>) 1.0-1.8 (9H, m), 2.8-3.4 (3H, m),  
7.1-7.2 (1H, m), 7.3-7.7 (3H, m), 7.73 (1H, s)

化合物 1 8 2

10 融点: 183.8°C

<sup>1</sup>H-NMR δ (ppm; TMS): (CDCl<sub>3</sub>) 0.96 (3H, d, J=6.5Hz), 1.1-1.3 (2H, m), 1.4-1.6 (1H, m), 1.6-1.7 (2H, m), 2.5-2.7 (2H, m), 3.2-3.4 (2H, m),  
7.1-7.2 (1H, m), 7.3-7.5 (2H, m), 7.40 (1H, d, J=1Hz), 7.78 (1H, d, J=1Hz)

化合物 1 8 7

15 <sup>1</sup>H-NMR δ (ppm; TMS): (CDCl<sub>3</sub>) 1.5-1.7 (8H, m), 3.1-3.2 (4H, m), 7.16 (1H, dt, J=1.4Hz, 8.2Hz), 7.3-7.5 (2H, m), 7.51 (1H, d, J=1.4Hz), 7.74 (1H, d, J=1.7Hz)

化合物 2 2 6

<sup>1</sup>H-NMR δ (ppm; TMS): (CDCl<sub>3</sub>) 1.04 (3H, d, J=6.4Hz), 1.2-1.7 (6H, m), 2.7-3.4 (3H, m), 7.0-7.1 (2H, m), 7.4-7.6 (2H, m), 7.74 (1H, d, J=1.4Hz)  
20

化合物 2 2 8

<sup>1</sup>H-NMR δ (ppm; TMS): (CDCl<sub>3</sub>) 0.96 (3H, d, J=6.3Hz), 1.1-1.3 (2H, m), 1.4-1.6 (1H, m), 1.6-1.7 (2H, m), 2.5-2.7 (2H, m), 3.2-3.3 (2H, m), 7.04 (2H, dd, J=7.0Hz, 8.5Hz), 7.38 (1H, d, J=1.4Hz), 7.4-7.5 (1H, m), 7.74 (1H, d, J=1.4Hz)  
25

化合物 2 3 3

<sup>1</sup>H-NMR δ (ppm; TMS): (CDCl<sub>3</sub>) 1.5-1.8 (8H, m), 3.0-3.2 (4H, m), 6.99 (2H, dd, J=7.0Hz, 8.5Hz), 7.4-7.6 (1H, m), 7.51 (1H, d, J=1.7Hz), 7.74 (1H, d, J=1.4Hz)

## 化合物 2 4 9

$^1\text{H-NMR}$   $\delta$  (ppm; TMS): ( $\text{CDCl}_3$ ) 0.94 (3H, d,  $J=6.4\text{Hz}$ ), 1.1-1.3 (2H, m), 1.3-1.5 (1H, m), 1.6-1.7 (2H, m), 2.2-2.5 (2H, m), 3.1-3.3 (2H, m), 7.2-7.3 (2H, m), 7.43 (1H, d,  $J=1\text{Hz}$ ), 7.4-7.6 (3H, m), 7.74 (1H, d,  $J=1\text{Hz}$ )

## 5 化合物 2 5 0

$^1\text{H-NMR}$   $\delta$  (ppm; TMS): ( $\text{CDCl}_3$ ) 0.8-1.8 (9H, m), 2.1-2.5 (1H, m), 2.7-2.9 (1H, m), 3.1-3.4 (1H, m), 7.2-7.3 (1H, m), 7.3-7.7 (5H, m), 7.73 (1H, s)

## 化合物 2 5 1

10  $^1\text{H-NMR}$   $\delta$  (ppm; TMS): ( $\text{CDCl}_3$ ) 1.5-1.7 (8H, m), 2.9-3.1 (4H, m), 7.2-7.3 (2H, m), 7.4-7.6 (4H, m), 7.73 (1H, d,  $J=1.2\text{Hz}$ )

## 化合物 2 5 3

15  $^1\text{H-NMR}$   $\delta$  (ppm; TMS): ( $\text{CDCl}_3$ ) 0.94 (3H, d,  $J=6.3\text{Hz}$ ), 1.1-1.5 (3H, m), 1.5-1.7 (2H, m), 2.3-2.6 (2H, m), 3.1-3.4 (2H, m), 7.2-7.3 (1H, m), 7.3-7.5 (3H, m), 7.5-7.6 (1H, m), 7.73 (1H, d,  $J=1.4\text{Hz}$ )

## 化合物 2 5 5

$^1\text{H-NMR}$   $\delta$  (ppm; TMS): ( $\text{CDCl}_3$ ) 1.5-1.8 (8H, m), 3.0-3.2 (4H, m), 7.23 (1H, dd,  $J=1.9\text{Hz}$ ,  $7.2\text{Hz}$ ), 7.3-7.5 (2H, m), 7.51 (1H, d,  $J=1.4\text{Hz}$ ), 7.55 (1H, dd,  $J=1.7\text{Hz}$ ,  $7.5\text{Hz}$ ), 7.73 (1H, d,  $J=1.4\text{Hz}$ )

## 20 化合物 2 5 7

$^1\text{H-NMR}$   $\delta$  (ppm; TMS): ( $\text{CDCl}_3$ ) 0.95 (3H, d,  $J=6.5\text{Hz}$ ), 1.1-1.4 (2H, m), 1.4-1.7 (3H, m), 2.3-2.6 (2H, m), 3.1-3.4 (2H, m), 7.2-7.3 (3H, m), 7.38 (1H, d,  $J=1.4\text{Hz}$ ), 7.4-7.5 (1H, m), 7.73 (1H, d,  $J=1.4\text{Hz}$ )

## 化合物 2 5 8

25  $^1\text{H-NMR}$   $\delta$  (ppm; TMS): ( $\text{CDCl}_3$ ) 1.0-1.2 (3H, m), 1.3-1.8 (4H, m), 2.3-2.8 (2H, m), 2.8-3.5 (3H, m), 7.2-7.6 (5H, m), 7.73 (1H, d,  $J=1.4\text{Hz}$ )

## 化合物 2 5 9

$^1\text{H-NMR}$   $\delta$  (ppm; TMS): ( $\text{CDCl}_3$ ) 1.5-1.8 (8H, m), 3.0-3.1 (4H, m), 7.2-7.4 (3H, m), 7.4-7.6 (2H, m), 7.73 (1H, d,  $J=1.2\text{Hz}$ )

## 化合物 2 6 1

$^1\text{H-NMR}$   $\delta$  (ppm; TMS): ( $\text{CDCl}_3$ ) 0.92 (3H, d,  $J=6.3\text{Hz}$ ), 1.1-1.5 (3H, m), 1.5-1.7 (2H, m), 2.1-2.3 (1H, m), 2.21 (3H, s), 2.5-2.6 (1H, m), 2.8-3.0 (1H, m), 3.3-3.5 (1H, m), 7.03 (1H, d,  $J=7.5\text{Hz}$ ), 7.2-7.4 (4H, m), 7.73 (1H, d,  $J=1.4\text{Hz}$ )

## 化合物 2 6 3

$^1\text{H-NMR}$   $\delta$  (ppm; TMS): ( $\text{CDCl}_3$ ) 1.4-1.7 (8H, m), 2.9-3.1 (4H, m), 7.04 (1H, dd,  $J=1.1\text{Hz}, 7.5\text{Hz}$ ), 7.2-7.4 (3H, m), 7.51 (1H, d,  $J=1.4\text{Hz}$ ), 7.74 (1H, d,  $J=1.4\text{Hz}$ )

## 10 化合物 2 6 5

$^1\text{H-NMR}$   $\delta$  (ppm; TMS): ( $\text{CDCl}_3$ ) 0.93 (3H, d,  $J=6.5\text{Hz}$ ), 1.1-1.3 (2H, m), 1.3-1.5 (2H, m), 1.5-1.7 (2H, m), 2.2-2.6 (2H, m), 3.2-3.4 (2H, m), 7.3-7.4 (2H, m), 7.6-7.7 (2H, m), 7.7-7.9 (2H, m)

## 化合物 2 6 7

15  $^1\text{H-NMR}$   $\delta$  (ppm; TMS): ( $\text{CDCl}_3$ ) 1.4-1.7 (8H, m), 3.0-3.2 (4H, m), 7.31 (1H, d,  $J=7.5\text{Hz}$ ), 7.49 (1H, d,  $J=1.4\text{Hz}$ ), 7.6-7.7 (2H, m), 7.73 (1H, d,  $J=1.7\text{Hz}$ ), 7.82 (1H, d,  $J=7.5\text{Hz}$ )

## 化合物 2 8 1

20  $^1\text{H-NMR}$   $\delta$  (ppm; TMS): ( $\text{CDCl}_3$ ) 0.95 (3H, d,  $J=6.5\text{Hz}$ ), 1.1-1.3 (2H, m), 1.3-1.5 (1H, m), 1.6-1.7 (2H, m), 2.3-2.5 (2H, m), 3.1-3.3 (2H, m), 7.1-7.3 (4H, m), 7.37 (1H, d,  $J=1\text{Hz}$ ), 7.72 (1H, d,  $J=1\text{Hz}$ )

## 化合物 2 8 2

$^1\text{H-NMR}$   $\delta$  (ppm; TMS): ( $\text{CDCl}_3$ ) 0.8-1.1 (3H, m), 1.2-1.8 (6H, m), 2.2-2.8 (2H, m), 3.1-3.5 (1H, m), 7.1-7.7 (5H, m), 7.74 (1H, d,  $J=1.4\text{Hz}$ )

## 25 化合物 2 8 3

$^1\text{H-NMR}$   $\delta$  (ppm; TMS): ( $\text{CDCl}_3$ ) 1.5-1.7 (8H, m), 2.9-3.1 (4H, m), 7.1-7.3 (4H, m), 7.51 (1H, d,  $J=1.4\text{Hz}$ ), 7.73 (1H, d,  $J=1.4\text{Hz}$ )

## 化合物 2 8 5

$^1\text{H-NMR}$   $\delta$  (ppm; TMS): ( $\text{CDCl}_3$ ) 0.96 (3H, d,  $J=6.2\text{Hz}$ ), 1.1-1.4 (2H,

m), 1.4-1.6 (1H, m), 1.6-1.7 (2H, m), 2.5-2.7 (2H, m), 3.3-3.4 (2H, m),  
7.3-7.4 (2H, m), 7.4-7.6 (2H, m), 7.74 (1H, d, J=1Hz)

## 化合物 2 8 6

<sup>1</sup>H-NMR δ (ppm; TMS): (CDCl<sub>3</sub>) 1.17 (3H, d, J=6.7Hz), 1.2-1.7 (6H,  
5 m), 3.0-3.7 (3H, m), 7.3-7.4 (1H, m), 7.4-7.6 (3H, m), 7.71 (1H, s)

## 化合物 2 8 7

<sup>1</sup>H-NMR δ (ppm; TMS): (CDCl<sub>3</sub>) 1.5-1.7 (8H, m), 3.1-3.3 (4H, m),  
7.3-7.4 (1H, m), 7.4-7.5 (2H, m), 7.51 (1H, d, J=1.4Hz), 7.74 (1H, d, J=1.4Hz)

## 化合物 2 9 3

10 <sup>1</sup>H-NMR δ (ppm; TMS): (CDCl<sub>3</sub>) 0.97 (3H, d, J=6.3Hz), 1.2-1.4 (2H,  
m), 1.4-1.6 (1H, m), 1.6-1.7 (2H, m), 2.4-2.6 (2H, m), 3.1-3.4 (2H, m),  
6.9-7.1 (2H, m), 7.1-7.3 (1H, m), 7.38 (1H, d, J=1.4Hz), 7.74 (1H, d,  
J=1.4Hz)

## 化合物 2 9 5

15 <sup>1</sup>H-NMR δ (ppm; TMS): (CDCl<sub>3</sub>) 1.5-1.8 (8H, m), 3.0-3.1 (4H, m),  
6.9-7.1 (2H, m), 7.1-7.3 (1H, m), 7.51 (1H, d, J=1.4Hz), 7.74 (1H, d, J=1.7Hz)

## 化合物 2 9 7

<sup>1</sup>H-NMR δ (ppm; TMS): (CDCl<sub>3</sub>) 0.98 (3H, d, J=6.3Hz), 1.2-1.4 (2H, m),  
1.4-1.8 (3H, m), 2.4-2.6 (2H, m), 3.2-3.3 (2H, m), 7.18 (2H, s), 7.4-7.5 (2H,  
20 m), 7.74 (1H, d, J=0.7Hz)

## 化合物 2 9 9

<sup>1</sup>H-NMR δ (ppm; TMS): (CDCl<sub>3</sub>) 1.5-1.8 (8H, m), 3.0-3.1 (4H, m), 7.20  
(2H, d, J=1.4Hz), 7.4-7.5 (1H, m), 7.51 (1H, d, J=1.2Hz), 7.75 (1H, d,  
J=1.2Hz)

## 25 化合物 4 2 8

融点: 144.5°C

<sup>1</sup>H-NMR δ (ppm; TMS): (CDCl<sub>3</sub>) 0.95 (3H, d, J=6.3Hz), 1.1-1.3 (2H,  
m), 1.3-1.5 (1H, m), 1.6-1.7 (2H, m), 2.29 (3H, s), 2.4-2.6 (2H, m), 3.2-3.3  
(2H, m), 7.1-7.2 (1H, m), 7.3-7.5 (3H, m), 7.76 (1H, d, J=2Hz)

## 化合物 4 4 9

$^1\text{H-NMR}$   $\delta$  (ppm; TMS): ( $\text{CDCl}_3$ ) 0.94 (3H, m), 1.20 (3H, t,  $J=7\text{Hz}$ ), 1.2-1.4 (2H, m), 1.4-1.5 (1H, m), 1.6-1.7 (2H, m), 2.3-2.6 (4H, m), 3.2-3.3 (2H, m), 7.1-7.2 (1H, m), 7.3-7.5 (3H, m), 7.71 (1H, d,  $J=1.6\text{Hz}$ )

## 5 化合物 5 1 8

$^1\text{H-NMR}$   $\delta$  (ppm; TMS): ( $\text{CDCl}_3$ ) 2.8-3.0 (2H, m), 3.2-3.3 (2H, m), 4.2-4.4 (2H, m), 6.73 (2H, dd,  $J=7.7\text{Hz}, 8.2\text{Hz}$ ), 6.87 (1H, d,  $J=7.2\text{Hz}$ ), 7.1-7.3 (3H, m), 7.40 (1H, d,  $J=1\text{Hz}$ ), 7.74 (1H, d,  $J=1\text{Hz}$ )

## 化合物 5 2 1

10  $^1\text{H-NMR}$   $\delta$  (ppm; TMS): ( $\text{CDCl}_3$ ) 6.5-6.6 (1H, m), 6.7-6.8 (1H, m), 7.06 (1H, d,  $J=8.3\text{Hz}$ ), 7.12 (1H, d,  $J=1.5\text{Hz}$ ), 7.3-7.5 (2H, m), 7.8-7.9 (3H, m)

## 化合物 5 3 5

15  $^1\text{H-NMR}$   $\delta$  (ppm; TMS): ( $\text{CDCl}_3$ ) 0.86 (3H, d,  $J=7.3\text{Hz}$ ), 1.2-1.3 (2H, m), 1.4-1.6 (2H, m), 2.7-2.9 (5H, m), 6.84 (2H, dd,  $J=7.2\text{Hz}, 8.5\text{Hz}$ ), 7.44 (1H, d,  $J=1.4\text{Hz}$ ), 7.74 (1H, d,  $J=1.4\text{Hz}$ )

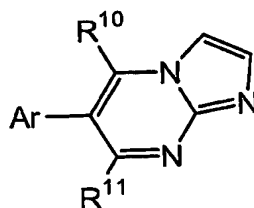
## 化合物 5 3 7

$^1\text{H-NMR}$   $\delta$  (ppm; TMS): ( $\text{CDCl}_3$ ) 2.41 (1H, t,  $J=2.4\text{Hz}$ ), 2.75 (3H, s), 3.81 (2H, d,  $J=2.4\text{Hz}$ ), 6.84 (2H, dd,  $J=7.4\text{Hz}, 8.3\text{Hz}$ ), 7.64 (1H, d,  $J=1.4\text{Hz}$ ), 7.78 (1H, d,  $J=1.2\text{Hz}$ )

20

更に、製造中間体のイミダゾ[1, 2-a]ピリミジン[II]、イミダゾ[1, 2-a]ピリミジン[III] およびイミダゾ[1, 2-a]ピリミジン[IV]を化合物番号とともに例示する。

下式



25

で示される化合物。

表 2

化合物番号	Ar	R <sup>10</sup>	R <sup>11</sup>
2-1	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl	Cl
2-2	2-Cl-6-F-Ph	Cl	Cl
2-3	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Cl	Cl
2-4	Ph	Cl	Cl
2-5	2-Cl-Ph	Cl	Cl
2-6	2-F-Ph	Cl	Cl
2-7	2-Me-Ph	Cl	Cl
2-8	2-CF <sub>3</sub> -Ph	Cl	Cl
2-9	3-Cl-Ph	Cl	Cl
2-10	3-F-Ph	Cl	Cl
2-11	4-Cl-Ph	Cl	Cl
2-12	4-F-Ph	Cl	Cl
2-13	2,6-Cl <sub>2</sub> -Ph	Cl	Cl
2-14	2,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	Cl	Cl
2-15	2,4-F <sub>2</sub> -Ph	Cl	Cl
2-16	3,5-Cl <sub>2</sub> -Ph	Cl	Cl
2-17	3,5-F <sub>2</sub> -Ph	Cl	Cl
2-18	2,4,6-Cl <sub>3</sub> -Ph	Cl	Cl
2-19	2,6-Cl <sub>2</sub> -4-F-Ph	Cl	Cl
2-20	2,4-Cl <sub>2</sub> -6-F-Ph	Cl	Cl
2-21	2-Cl-4,6-F <sub>2</sub> -Ph	Cl	Cl
2-22	4-Cl-2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Cl	Cl
2-23	2,6-F <sub>2</sub> -4-(MeO)-Ph	Cl	Cl
2-24	2,3,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl	Cl
2-25	2,3,4,5,6-F <sub>5</sub> -Ph	Cl	Cl

(表 2 の続き)

化合物番号	Ar	R <sup>10</sup>	R <sup>11</sup>
2-26	3-F-6-CF <sub>3</sub> -Ph	Cl	Cl
2-27	2,4,6-Me <sub>3</sub> -Ph	Cl	Cl
2-28	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl	Me
2-29	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl	Et
2-30	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl	Pr
2-31	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	Cl	i-Pr
2-32	2-Cl-6-F-Ph	Cl	Me
2-33	2-Cl-6-F-Ph	Cl	Et
2-34	2-Cl-6-F-Ph	Cl	Pr
2-35	2-Cl-6-F-Ph	Cl	i-Pr
2-36	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Cl	Me
2-37	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Cl	Et
2-38	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Cl	Pr
2-39	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	Cl	i-Pr
3-1	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	OH	OH
3-2	2-Cl-6-F-Ph	OH	OH
3-3	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	OH	OH
3-4	Ph	OH	OH
3-5	2-Cl-Ph	OH	OH
3-6	2-F-Ph	OH	OH
3-7	2-Me-Ph	OH	OH
3-8	2-CF <sub>3</sub> -Ph	OH	OH
3-9	3-Cl-Ph	OH	OH
3-10	3-F-Ph	OH	OH
3-11	4-Cl-Ph	OH	OH

(表 2 の続き)

化合物番号	Ar	R <sup>10</sup>	R <sup>11</sup>
3-12	4-F-Ph	OH	OH
3-13	2,6-Cl <sub>2</sub> -Ph	OH	OH
3-14	2,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	OH	OH
3-15	2,4-F <sub>2</sub> -Ph	OH	OH
3-16	3,5-Cl <sub>2</sub> -Ph	OH	OH
3-17	3,5-F <sub>2</sub> -Ph	OH	OH
3-18	2,4,6-Cl <sub>3</sub> -Ph	OH	OH
3-19	2,6-Cl <sub>2</sub> -4-F-Ph	OH	OH
3-20	2,4-Cl <sub>2</sub> -6-F-Ph	OH	OH
3-21	2-Cl-4,6-F <sub>2</sub> -Ph	OH	OH
3-22	4-Cl-2,6-F <sub>2</sub> -Ph	OH	OH
3-23	2,6-F <sub>2</sub> -4-(MeO)-Ph	OH	OH
3-24	2,3,6-F <sub>3</sub> -Ph	OH	OH
3-25	2,3,4,5,6-F <sub>5</sub> -Ph	OH	OH
3-26	3-F-6-CF <sub>3</sub> -Ph	OH	OH
3-27	2,4,6-Me <sub>3</sub> -Ph	OH	OH
4-1	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	OH	Me
4-2	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	OH	Et
4-3	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	OH	Pr
4-4	2,4,6-F <sub>3</sub> -Ph	OH	i-Pr
4-5	2-Cl-6-F-Ph	OH	Me
4-6	2-Cl-6-F-Ph	OH	Et
4-7	2-Cl-6-F-Ph	OH	Pr
4-8	2-Cl-6-F-Ph	OH	i-Pr
4-9	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	OH	Me

(表 2 の続き)

化合物番号	Ar	R <sup>10</sup>	R <sup>11</sup>
4-10	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	OH	Et
4-11	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	OH	Pr
4-12	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	OH	i-Pr

製造中間体のイミダゾ [1, 2-a] ピリミジン [I I]、イミダゾ [1, 2-a] ピリミジン [I I I] およびイミダゾ [1, 2-a] ピリミジン [I V] の  
5 いくつかについて、その物性値を示す。

## 化合物 2-1

融点 : 192.5°C

<sup>1</sup>H-NMR δ (ppm; TMS): (CDCl<sub>3</sub>) 6.88 (2H, dd, J=8.6Hz, 7.1Hz), 7.75 (1H, d, J=1Hz), 7.92 (1H, d, J=1Hz)

## 化合物 2-2

融点 : 223.6°C

<sup>1</sup>H-NMR δ (ppm; TMS): (CDCl<sub>3</sub>) 7.1-7.2 (1H, m), 7.4-7.6 (2H, m), 7.76 (1H, d, J=1Hz), 7.92 (1H, d, J=1Hz)

## 15 化合物 2-3

<sup>1</sup>H-NMR δ (ppm; TMS): (CDCl<sub>3</sub>) 7.09 (2H, dd, J=7.5Hz, 8.2Hz), 7.5-7.6 (1H, m), 7.74 (1H, d, J=1.7Hz), 7.90 (1H, d, J=1.2Hz)

## 化合物 2-4

<sup>1</sup>H-NMR δ (ppm; TMS): (CDCl<sub>3</sub>) 7.3-7.4 (2H, m), 7.5-7.6 (3H, m), 7.72 (1H, d, J=1.7Hz), 7.89 (1H, d, J=1.7Hz)

## 化合物 2-5

<sup>1</sup>H-NMR δ (ppm; TMS): (CDCl<sub>3</sub>) 7.32 (1H, dd, J=1.7Hz, 7.6Hz), 7.4-7.5 (2H, m), 7.58 (1H, dd, J=1.3Hz, 7.9Hz), 7.73 (1H, d, J=1.5Hz), 7.90 (1H, d, J=1.7Hz)

## 25 化合物 2-6

$^1\text{H-NMR}$   $\delta$  (ppm; TMS) : ( $\text{CDCl}_3$ ) 7.2-7.3 (1H, m), 7.3-7.4 (2H, m),  
7.5-7.6 (1H, m), 7.73 (1H, d,  $J=1.4\text{Hz}$ ), 7.89 (1H, d,  $J=1.5\text{Hz}$ )

## 化合物 2-7

$^1\text{H-NMR}$   $\delta$  (ppm; TMS) : ( $\text{CDCl}_3$ ) 2.15 (3H, s), 7.12 (1H, dd,  $J=1.0\text{Hz}$ ,  
5 7.6Hz), 7.3-7.5 (2H, m), 7.72 (1H, d,  $J=1.7\text{Hz}$ ), 7.90 (1H, d,  $J=1.7\text{Hz}$ )

## 化合物 2-8

$^1\text{H-NMR}$   $\delta$  (ppm; TMS) : ( $\text{CDCl}_3$ ) 7.35 (1H, d,  $J=7.5\text{Hz}$ ), 7.6-7.8 (2H,  
m), 7.72 (1H, d,  $J=1.5\text{Hz}$ ), 7.87 (1H, d,  $J=7.7\text{Hz}$ ), 7.90 (1H, d,  $J=1.5\text{Hz}$ )

## 化合物 2-12

10  $^1\text{H-NMR}$   $\delta$  (ppm; TMS) : ( $\text{CDCl}_3$ ) 7.2-7.3 (2H, m), 7.3-7.4 (2H, m), 7.72  
(1H, d,  $J=1.5\text{Hz}$ ), 7.89 (1H, d,  $J=1.7\text{Hz}$ )

## 化合物 2-13

$^1\text{H-NMR}$   $\delta$  (ppm; TMS) : ( $\text{CDCl}_3$ ) 7.41-7.46 (1H, m), 7.50-7.53 (2H, m),  
7.76 (1H, d,  $J=1.5\text{Hz}$ ), 7.92 (1H, d,  $J=1.4\text{Hz}$ )

## 15 化合物 2-15

$^1\text{H-NMR}$   $\delta$  (ppm; TMS) : ( $\text{CDCl}_3$ ) 6.9-7.1 (2H, m), 7.2-7.3 (1H, m), 7.73  
(1H, d,  $J=1.5\text{Hz}$ ), 7.90 (1H, d,  $J=1.5\text{Hz}$ )

## 化合物 2-16

$^1\text{H-NMR}$   $\delta$  (ppm; TMS) : ( $\text{CDCl}_3$ ) 7.2-7.3 (2H, m), 7.52 (1H, dt,  $J=0.5\text{Hz}$ ,  
20 1.9Hz), 7.73 (1H, d,  $J=1\text{Hz}$ ), 7.91 (1H, d,  $J=1.2\text{Hz}$ )

## 化合物 2-32

融点 : 244.6 $^{\circ}\text{C}$

$^1\text{H-NMR}$   $\delta$  (ppm; TMS) : ( $\text{CDCl}_3$ ) 2.43 (3H, s), 7.24 (1H, t,  $J=8\text{Hz}$ ),  
7.4-7.6 (2H, m), 7.71 (1H, s), 7.88 (1H, s)

## 25 化合物 2-33

$^1\text{H-NMR}$   $\delta$  (ppm; TMS) : ( $\text{CDCl}_3$ ) 1.27 (3H, t,  $J=7\text{Hz}$ ), 2.6-2.7 (2H, m),  
7.19 (1H, dt,  $J=8\text{Hz}$ ,  $1\text{Hz}$ ), 7.3-7.5 (2H, m), 7.69 (1H, d,  $J=1.6\text{Hz}$ ), 7.85 (1H,  
d,  $J=1.6\text{Hz}$ )

## 化合物 3-1

$^1\text{H-NMR}$   $\delta$  (ppm; TMS): (DMSO- $d_6$ ) 7.11 (2H, dd,  $J=7.7\text{Hz}$ ,  $9.2\text{Hz}$ ), 7.39 (1H, d,  $J=2.5\text{Hz}$ ), 7.48 (1H, d,  $J=2.5\text{Hz}$ ), 11.9 (2H, brs)

化合物 3-2 (DBN 塩)

$^1\text{H-NMR}$   $\delta$  (ppm; TMS): (DMSO- $d_6$ ) 1.8-1.9 (2H, m), 1.9-2.0 (2H, m),  
5 2.76 (2H, t,  $J=7.9\text{Hz}$ ), 3.27 (2H, t,  $J=5.7$ ), 3.35 (2H, t,  $J=5.7\text{Hz}$ ), 3.58 (2H, t,  $J=7.2\text{Hz}$ ), 6.69 (1H, d,  $J=1.6\text{Hz}$ ), 7.0-7.1 (1H, m), 7.07 (1H, d,  $J=1.6\text{Hz}$ ), 7.1-7.2 (2H, m), 10.35 (2H, brs)

化合物 3-3

$^1\text{H-NMR}$   $\delta$  (ppm; TMS): (DMSO- $d_6$ ) 7.05 (2H, t,  $J=8\text{Hz}$ ), 7.3-7.4 (1H, m),  
10 7.40 (1H, d,  $J=2\text{Hz}$ ), 7.49 (1H, d,  $J=2\text{Hz}$ ), 11.94 (2H, brs)

化合物 3-4

$^1\text{H-NMR}$   $\delta$  (ppm; TMS): (DMSO- $d_6$ ) 7.15 (1H, t,  $J=7\text{Hz}$ ), 7.29 (2H, t,  $J=7\text{Hz}$ ), 7.38 (1H, d,  $J=2.4\text{Hz}$ ), 7.46 (2H, d,  $J=7\text{Hz}$ ), 7.49 (1H, d,  $J=2.4\text{Hz}$ ), 11.74 (brs)

15 化合物 3-5

$^1\text{H-NMR}$   $\delta$  (ppm; TMS): (DMSO- $d_6$ ) 7.2-7.3 (3H, m), 7.38 (1H, d,  $J=2.6\text{Hz}$ ), 7.4-7.5 (1H, m), 7.49 (1H, d,  $J=2.4\text{Hz}$ ), 12.5 (brs)

化合物 3-6

$^1\text{H-NMR}$   $\delta$  (ppm; TMS): (DMSO- $d_6$ ) 7.1-7.2 (2H, m), 7.2-7.4 (2H, m),  
20 7.39 (1H, d,  $J=2.7\text{Hz}$ ), 7.50 (1H, d,  $J=2.4\text{Hz}$ ), 12.6 (brs)

化合物 3-7

$^1\text{H-NMR}$   $\delta$  (ppm; TMS): (DMSO- $d_6$ ) 2.11 (3H, s), 7.1-7.2 (4H, m), 7.3-7.4 (1H, m), 7.4-7.5 (1H, m), 12.5 (brs)

化合物 3-8

$^1\text{H-NMR}$   $\delta$  (ppm; TMS): (DMSO- $d_6$ ) 7.30 (1H, d,  $J=7.7\text{Hz}$ ), 7.37 (1H, d,  $J=2.4\text{Hz}$ ), 7.4-7.6 (2H, m), 7.64 (1H, t,  $J=7.5\text{Hz}$ ), 7.73 (1H, d,  $J=8.0\text{Hz}$ )  
25

化合物 3-12

$^1\text{H-NMR}$   $\delta$  (ppm; TMS): (DMSO- $d_6$ ) 7.11 (2H, t,  $J=8.8\text{Hz}$ ), 7.38 (1H, d,  $J=2.4\text{Hz}$ ), 7.4-7.5 (3H, m), 11.4 (brs), 12.3 (brs)

## 化合物 3-13 (DBU 塩)

$^1\text{H-NMR}$   $\delta$  (ppm; TMS): (DMSO- $d_6$ ) 1.59-1.67 (6H, m), 1.87-1.94 (2H, m), 2.49-2.51 (2H, m), 3.23 (2H, t,  $J=5.6\text{Hz}$ ), 3.46 (2H, t,  $J=5.7\text{Hz}$ ), 3.52-3.56 (2H, m), 6.69 (1H, d,  $J=1.5\text{Hz}$ ), 7.09 (1H, d,  $J=1.5\text{Hz}$ ), 7.15-7.20 (1H, m),  
5 7.35 (2H, d,  $J=8.0\text{Hz}$ ), 9.5 (brs), 10.3 (brs)

## 化合物 3-15

$^1\text{H-NMR}$   $\delta$  (ppm; TMS): (DMSO- $d_6$ ) 7.04 (1H, dt,  $J=2.4\text{Hz}, 8.5\text{Hz}$ ), 7.16 (1H, dt,  $J=2.6\text{Hz}, 9.7\text{Hz}$ ), 7.34 (1H, dt,  $J=7.0\text{Hz}, 8.5\text{Hz}$ ), 7.40 (1H, d,  $J=2.4\text{Hz}$ ),  
7.49 (1H, d,  $J=2.4\text{Hz}$ )

## 10 化合物 3-16

$^1\text{H-NMR}$   $\delta$  (ppm; TMS): (DMSO- $d_6$ ) 7.3-7.4 (2H, m), 7.52 (1H, d,  $J=2.6\text{Hz}$ ),  
7.59 (2H, dt,  $J=1.7\text{Hz}$ )

## 化合物 4-5

$^1\text{H-NMR}$   $\delta$  (ppm; TMS): (DMSO- $d_6$ ) 2.03 (3H, s), 7.2-7.3 (1H, m),  
15 7.4-7.5 (2H, m), 7.51 (1H, d,  $J=2.4\text{Hz}$ ), 7.59 (1H, d,  $J=2.4\text{Hz}$ ), 12.90 (1H, brs)

## 化合物 4-6

$^1\text{H-NMR}$   $\delta$  (ppm; TMS): ( $\text{CDCl}_3$ ) 1.29 (3H, t,  $J=7\text{Hz}$ ), 2.5-2.6 (2H, m),  
7.0-7.2 (2H, m), 7.3-7.4 (2H, m), 7.67 (1H, d,  $J=2.3\text{Hz}$ )

20

次に製剤例を示す。部は重量部を表し、本発明化合物は上表に記載の番号で示す。

## 製剤例 1

化合物 1-637 の各々 50 部、リグニンスルホン酸カルシウム 3 部、ラウリル硫酸マグネシウム 2 部及び合成含水酸化珪素 45 部をよく粉碎混合することにより、各々の水和剤を得る。  
25

## 製剤例 2

化合物 1-637 の各々 20 部とソルビタントリオレート 1.5 部とを、ポリビニルアルコールを 2 重量%含有する水溶液 28.5 部と混合し、湿式粉碎法

で微粉碎した後、この中に、キサンタンガムを0.05重量%及びアルミニウムマグネシウムシリケートを0.1重量%含有する水溶液40部を加え、さらにプロピレングリコール10部を加えて攪拌混合し各々のフロアブル製剤を得る。

#### 製剤例 3

- 5 化合物1～637の各々2部、カオリンクレー88部及びタルク10部をよく粉砕混合することにより、各々の粉剤を得る。

#### 製剤例 4

- 10 化合物1～637の各々5部、ポリオキシエチレンスチリルフェニルエーテル14部、ドデシルベンゼンスルホン酸カルシウム6部及びキシレン75部をよく混合することにより、各々の乳剤を得る。

#### 製剤例 5

化合物1～637の各々2部、合成含水酸化珪素1部、リグニンスルホン酸カルシウム2部、ベントナイト30部及びカオリンクレー65部をよく粉砕混合した後、水を加えてよく練り合せ、造粒乾燥することにより、各々の粒剤を得る。

#### 15 製剤例 6

化合物1～637の各々10部、ポリオキシエチレンアルキルエーテルサルフェートアンモニウム塩を50重量%含むホワイトカーボン35部及び水55部を混合し、湿式粉碎法で微粉碎することにより、各々のフロアブル製剤を得る。

- 20 次に、本発明化合物が植物病害の防除に有用であることを試験例で示す。なお、本発明化合物は上表に記載の番号で示す。

- 25 本発明化合物の防除効果は、調査時の供試植物上の病斑の面積を肉眼観察し、無処理区の病斑の面積と本発明化合物処理区の病斑の面積を比較することにより評価した。

#### 試験例 1：キュウリ灰色かび病防除効果試験（予防効果）

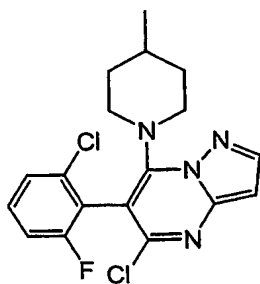
プラスチックポットに砂壤土を詰め、キュウリ（落合青長節成）を播種し、温室内で10日間生育させた。化合物7、8、9、21、29、49、50、52、53、54、55、63、65、71、72、73、81、83、85、89、

- 161、180、187、226、228、233、251、255、259、  
267、283、285、287、295、428、449、521および53  
5の各々を製剤例6に準じてフロアブル製剤とした後、水で所定濃度（500ppm）  
に希釈し、そのキュウリ子葉面に充分付着するように茎葉散布した。散布後植物  
5を風乾し、キュウリ灰色かび病菌の胞子含有 PDA 培地をキュウリ子葉面上に置い  
た。接種後 12℃、多湿下に 4 日置いた後、防除効果を調査した。その結果、上記  
本発明化合物処理区の植物上の病斑面積は、いずれも無処理区の病斑面積の 3  
0 % 以下であった。

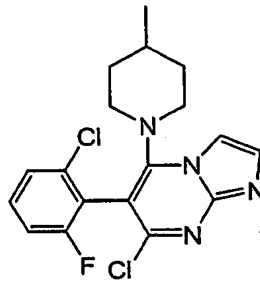
試験例 2：キュウリうどんこ病防除効果試験（予防効果）

- 10 プラスチックポットに砂壤土を詰め、キュウリ（落合青長節成）を播種し、温  
室内で 12 日間生育させた。化合物 1、4、7、8、20、52、55、76、8  
1、83、161および449の各々を製剤例6に準じてフロアブル製剤とした  
後、水で所定濃度（500ppm）に希釈し、そのキュウリ葉面に充分付着するように  
茎葉散布した。散布後植物を風乾し、キュウリうどんこ病菌の胞子を接種した。  
15 接種後 23℃下に 12 日置いた後、防除効果を調査した。その結果、上記本発明化  
合物処理区の植物上の病斑面積は、いずれも無処理区の病斑面積の 30 % 以下で  
あった。

- また、比較の為に、日本公開特許公報の特開 2001-19693 号の第 12  
20 頁に記載の例 12 の化合物（以下、比較化合物 A と記す。）と、本発明化合物の化  
合物 182 を用いて、試験を行った。



比較化合物 A



化合物 182

## 試験例 3 : キュウリ 灰色かび病防除効果試験 (予防効果)

- プラスチックポットに砂壤土を詰め、キュウリ (落合青長節成) を播種し、温室内で 10 日間生育させた。比較化合物 A および化合物 182 の各々を製剤例 6 に準じてフロアブル製剤とした後、水で所定濃度 (500ppm) に希釈し、そのキュウリ子葉面に充分付着するように茎葉散布した。散布後植物を風乾し、キュウリ灰色かび病菌の胞子含有 PDA 培地をキュウリ子葉面上に置いた。接種後 12℃、多湿下に 4 日置いた後、防除効果を調査した。その結果、比較化合物 A 処理区の植物の病斑面積は無処理区の病斑面積の 75%~100% の範囲であり、化合物 182 処理区の植物上の病斑面積は無処理区の病斑面積の 1% 以下であった。

10

## 試験例 4 : キュウリ うどんこ病防除効果試験 (予防効果)

- プラスチックポットに砂壤土を詰め、キュウリ (落合青長節成) を播種し、温室内で 12 日間生育させた。比較化合物 A および化合物 182 の各々を製剤例 6 に準じてフロアブル製剤とした後、水で所定濃度 (500ppm) に希釈し、そのキュウリ葉面に充分付着するように茎葉散布した。散布後植物を風乾し、キュウリうどんこ病菌の胞子を接種した。接種後 23℃ 下に 12 日置いた後、防除効果を調査した。その結果、比較化合物 A 処理区の植物の病斑面積は無処理区の病斑面積の 75%~100% の範囲であり、化合物 182 処理区の植物上の病斑面積は無処理区の病斑面積の 1% 以下であった。

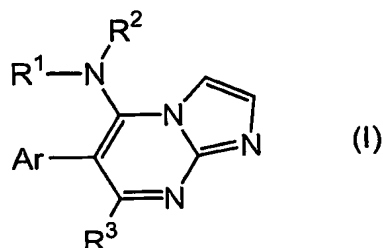
20

産業上の利用可能性

本発明化合物を用いることにより、植物病害を防除することができる。

## 請求の範囲

## 1. 下式 [I]



- [式中、R<sup>1</sup> は水素原子；C 1－C 4アルコキシ基、C 2－C 8ジアルキルアミノ基、C 1－C 4アルキルチオ基、C 2－C 5アルコキシカルボニル基、シアノ基およびハロゲン原子からなる群より選ばれる1種以上で置換されていてもよいC 1－C 6アルキル基；ハロゲン原子で置換されていてもよいC 3－C 6アルケニル基；ハロゲン原子で置換されていてもよいC 3－C 6アルキニル基；C 1－C 4アルキル基およびハロゲン原子からなる群より選ばれる1種以上で置換されていてもよいC 3－C 8シクロアルキル基；C 1－C 4アルキル基、C 1－C 4アルコキシ基、C 1－C 4アルキルチオ基、C 1－C 3ハロアルキル基、C 1－C 3ハロアルコキシ基、ハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基およびC 2－C 5アルコキシカルボニル基からなる群より選ばれる1種以上でベンゼン環上にて置換されていてもよいフェニル基あるいはフェニルC 1－C 2アルキル基；またはC 1－C 4アルキル基、C 1－C 4アルコキシ基、C 1－C 4アルキルチオ基、C 1－C 3ハロアルキル基、ハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基およびC 2－C 5アルコキシカルボニル基からなる群より選ばれる1種以上で置換されていてもよい5－6員環の複素環基を表し、
- R<sup>2</sup> は水素原子；C 1－C 4アルコキシ基、C 2－C 8ジアルキルアミノ基、C 1－C 4アルキルチオ基、C 2－C 5アルコキシカルボニル基、シアノ基およびハロゲン原子からなる群より選ばれる1種以上で置換されていてもよいC 1－C 6アルキル基；ハロゲン原子で置換されていてもよいC 3－C 6アルケニル基；ハロゲン原子で置換されていてもよいC 3－C 6アルキニル基；C 1－C 4アルキル基およびハロゲン原子からなる群より選ばれる1種以上で置換されていてもよいC 3－C 8シクロアルキル基；C 1－C 4アルキル基、C 1－C 4アルコキ

- シ基、C1-C4アルキルチオ基、C1-C3ハロアルキル基、C1-C3ハロアルコキシ基、ハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基およびC2-C5アルコキシカルボニル基からなる群より選ばれる1種以上でベンゼン環上にて置換されていてもよいフェニル基あるいはフェニルC1-C2アルキル基；C1-C4アルキル基、C1-C4アルコキシ基、C1-C4アルキルチオ基、C1-C3ハロアルキル基、ハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基およびC2-C5アルコキシカルボニル基からなる群より選ばれる1種以上で置換されていてもよい5-6員環の複素環基；C1-C6アルキル基、フェニル基およびベンジル基（該フェニル基およびベンジル基は、C1-C4アルキル基、C1-C3ハロアルキル基およびハロゲン原子からなる群より選ばれる1種以上でベンゼン環上にて置換されていてもよい。）からなる群より選ばれる1種または2種で置換されていてもよいアミノ基；C1-C4アルコキシ基；フェノキシ基；ベンジルオキシ基を表すか、あるいは、R<sup>1</sup> およびR<sup>2</sup> は、R<sup>1</sup> とR<sup>2</sup> とが結合している窒素原子と一緒にあって、3-8員環の複素環基（該複素環基は、C1-C4アルキレン基またはC2-C4アルケニレン基で置換されて多環系複素環基を表していてもよく、C1-C4アルキル基、C1-C4アルコキシ基、C1-C4アルキルチオ基、C1-C3ハロアルキル基、C1-C4アシル基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、ニトロ基、シアノ基およびC2-C5アルコキシカルボニル基からなる群より選ばれる1種以上で置換されていてもよい。）を表し、
- R<sup>3</sup> はハロゲン原子またはC1-C4アルキル基を表し、
- A<sub>r</sub>はハロゲン原子、C1-C4アルキル基、C1-C4アルコキシ基またはC1-C3ハロアルキル基から選ばれる群より選ばれる1種以上で置換されていてもよいフェニル基を表す。]
- で示されるイミダゾ [1, 2-a] ピリミジン。

25

2. 式 [I] において、

R<sup>1</sup> が水素原子；C1-C4アルコキシ基、C2-C8ジアルキルアミノ基、C1-C4アルキルチオ基、C2-C5アルコキシカルボニル基、シアノ基およびハロゲン原子からなる群より選ばれる1種以上で置換されていてもよいC1-C

- 6 アルキル基；ハロゲン原子で置換されていてもよいC3－C6アルケニル基；ハロゲン原子で置換されていてもよいC3－C6アルキニル基；C1－C4アルキル基およびハロゲン原子からなる群より選ばれる1種以上で置換されていてもよいC3－C8シクロアルキル基；C1－C4アルキル基、C1－C4アルコキシ基、C1－C4アルキルチオ基、C1－C3ハロアルキル基、C1－C3ハロアルコキシ基、ハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基およびC2－C5アルコキシカルボニル基からなる群より選ばれる1種以上でベンゼン環上にて置換されていてもよいフェニル基あるいはフェニルC1－C2アルキル基；またはC1－C4アルキル基、C1－C4アルコキシ基、C1－C4アルキルチオ基、C1－C3ハロアルキル基、ハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基およびC2－C5アルコキシカルボニル基からなる群より選ばれる1種以上で置換されていてもよい5－6員環の複素環基であり、
- R<sup>2</sup> が水素原子；C1－C4アルコキシ基、C2－C8ジアルキルアミノ基、C1－C4アルキルチオ基、C2－C5アルコキシカルボニル基、シアノ基およびハロゲン原子からなる群より選ばれる1種以上で置換されていてもよいC1－C6アルキル基；ハロゲン原子で置換されていてもよいC3－C6アルケニル基；ハロゲン原子で置換されていてもよいC3－C6アルキニル基；C1－C4アルキル基およびハロゲン原子からなる群より選ばれる1種以上で置換されていてもよいC3－C8シクロアルキル基；C1－C4アルキル基、C1－C4アルコキシ基、C1－C4アルキルチオ基、C1－C3ハロアルキル基、C1－C3ハロアルコキシ基、ハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基およびC2－C5アルコキシカルボニル基からなる群より選ばれる1種以上でベンゼン環上にて置換されていてもよいフェニル基あるいはフェニルC1－C2アルキル基；C1－C4アルキル基、C1－C4アルコキシ基、C1－C4アルキルチオ基、C1－C3ハロアルキル基、ハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基およびC2－C5アルコキシカルボニル基からなる群より選ばれる1種以上で置換されていてもよい5－6員環の複素環基；C1－C6アルキル基、フェニル基およびベンジル基（該フェニル基およびベンジル基は、C1－C4アルキル基、C1－C3ハロアルキル基およびハロゲン原子からなる群より選ばれる1種以上でベンゼン環上にて置換されてい

てもよい。)からなる群より選ばれる1種または2種で置換されていてもよいアミノ基; C1-C4アルコキシ基; フェノキシ基; またはベンジルオキシ基であるか、

- 5 あるいは、R<sup>1</sup> およびR<sup>2</sup> が、R<sup>1</sup> とR<sup>2</sup> とが結合している窒素原子と一緒にあって、3-8員環の複素環基(該複素環基は、C1-C4アルキル基、C1-C4アルコキシ基、C1-C4アルキルチオ基、C1-C3ハロアルキル基、C1-C4アシル基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、ニトロ基、シアノ基およびC2-C5アルコキシカルボニル基からなる群より選ばれる1種以上で置換されていてもよい。)である請求項1に記載のイミダゾ[1, 2-a]ピリミジン。

10

3. 式[I]において、

- R<sup>1</sup> とR<sup>2</sup> が独立して、水素原子; C1-C4アルコキシ基、C2-C8ジアルキルアミノ基、C1-C4アルキルチオ基、C2-C5アルコキシカルボニル基、シアノ基およびハロゲン原子からなる群より選ばれる1種以上で置換されていてもよいC1-C6アルキル基; ハロゲン原子で置換されていてもよいC3-C6アルケニル基; ハロゲン原子で置換されていてもよいC3-C6アルキニル基; C1-C4アルキル基およびハロゲン原子からなる群より選ばれる1種以上で置換されていてもよいC3-C8シクロアルキル基; C1-C4アルキル基、C1-C4アルコキシ基、C1-C4アルキルチオ基、C1-C3ハロアルキル基、C1-C3ハロアルコキシ基、ハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基およびC2-C5アルコキシカルボニル基からなる群より選ばれる1種以上でベンゼン環上に置換されていてもよいフェニル基あるいはフェニルC1-C2アルキル基; またはC1-C4アルキル基、C1-C4アルコキシ基、C1-C4アルキルチオ基、C1-C3ハロアルキル基、ハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基およびC2-C5アルコキシカルボニル基からなる群より選ばれる1種以上で置換されていてもよい5-6員環の複素環基であるか、
- 15  
20  
25

あるいは、R<sup>1</sup> およびR<sup>2</sup> が、R<sup>1</sup> とR<sup>2</sup> とが結合している窒素原子と一緒にあって、3-8員環の複素環基(該複素環基は、C1-C4アルキレン基またはC2-C4アルケニレン基で置換されて多環系複素環基を表していてもよく、C1-

C 4 アルキル基、C 1 - C 4 アルコキシ基、C 1 - C 4 アルキルチオ基、C 1 - C 3 ハロアルキル基、C 1 - C 4 アシル基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、ニトロ基、シアノ基および C 2 - C 5 アルコキシカルボニル基からなる群より選ばれる 1 種以上で置換されていてもよい。) である請求項 1 に記載のイミダゾ [1, 2 - a] ピリミジン。

4. 式 [I] において、

R<sup>1</sup> と R<sup>2</sup> が独立して、水素原子；C 1 - C 4 アルコキシ基、C 2 - C 8 ジアルキルアミノ基、C 1 - C 4 アルキルチオ基、C 2 - C 5 アルコキシカルボニル基、  
10 シアノ基およびハロゲン原子からなる群より選ばれる 1 種以上で置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキル基；ハロゲン原子で置換されていてもよい C 3 - C 6 アルケニル基；ハロゲン原子で置換されていてもよい C 3 - C 6 アルキニル基；C 1 - C 4 アルキル基およびハロゲン原子からなる群より選ばれる 1 種以上で置換されていてもよい C 3 - C 8 シクロアルキル基；C 1 - C 4 アルキル基、C 1 - C 4 アルコキシ基、C 1 - C 4 アルキルチオ基、C 1 - C 3 ハロアルキル基、  
15 C 1 - C 3 ハロアルコキシ基、ハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基および C 2 - C 5 アルコキシカルボニル基からなる群より選ばれる 1 種以上でベンゼン環上に置換されていてもよいフェニル基あるいはフェニル C 1 - C 2 アルキル基；または C 1 - C 4 アルキル基、C 1 - C 4 アルコキシ基、C 1 - C 4 アルキルチオ基、C 1 - C 3 ハロアルキル基、ハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基および C 2 - C 5 アルコキシカルボニル基からなる群より選ばれる 1 種以上で置換されていてもよい 5 - 6 員環の複素環基であるか、

あるいは、R<sup>1</sup> および R<sup>2</sup> が、R<sup>1</sup> と R<sup>2</sup> とが結合している窒素原子と一緒にあって、3 - 8 員環の複素環基（該複素環基は、C 1 - C 4 アルキル基、C 1 - C 4 アルコキシ基、C 1 - C 4 アルキルチオ基、C 1 - C 3 ハロアルキル基、C 1 - C 4 アシル基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、ニトロ基、シアノ基および C 2 - C 5 アルコキシカルボニル基からなる群より選ばれる 1 種以上で置換されていてもよい。）である請求項 1 に記載のイミダゾ [1, 2 - a] ピリミジン。

5. 式 [I] において、

- R<sup>1</sup> および R<sup>2</sup> が独立して、水素原子；C 1－C 4アルコキシ基、C 2－C 8ジアルキルアミノ基、C 1－C 4アルキルチオ基、C 2－C 5アルコキシカルボニル基、シアノ基およびハロゲン原子のうちの1種以上によって置換されていてもよいC 1－C 6アルキル基；ハロゲン原子によって置換されていてもよいC 3－C 6アルケニル基；またはハロゲン原子によって置換されていてもよいC 3－C 6アルキニル基；C 1－C 4アルキル基およびハロゲン原子のうちの1種以上で置換されていてもよいC 3－C 8シクロアルキル基であるか、
- あるいはR<sup>1</sup> および R<sup>2</sup> が、R<sup>1</sup> と R<sup>2</sup> とが結合している窒素原子と一緒にあって、
- 10 3－8員環の複素環基（該複素環基は、C 1－C 4アルキレン基またはC 2－C 4アルケニレン基で置換されて多環系複素環基を表していてもよく、C 1－C 4アルキル基、C 1－C 4アルコキシ基、C 1－C 4アルキルチオ基、C 1－C 3ハロアルキル基、C 1－C 4アシル基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、ニトロ基、シアノ基およびC 2－C 5アルコキシカルボニル基からなる群より選ばれる1種
- 15 以上で置換されていてもよい。）である請求項1に記載のイミダゾ [1, 2-a] ピリミジン。

6. 式 [I] において、

- R<sup>1</sup> および R<sup>2</sup> が独立して、水素原子；C 1－C 4アルコキシ基、C 2－C 8ジアルキルアミノ基、C 1－C 4アルキルチオ基、C 2－C 5アルコキシカルボニル基、シアノ基およびハロゲン原子のうちの1種以上によって置換されていてもよいC 1－C 6アルキル基；ハロゲン原子によって置換されていてもよいC 3－C 6アルケニル基；またはハロゲン原子によって置換されていてもよいC 3－C 6アルキニル基；C 1－C 4アルキル基およびハロゲン原子のうちの1種以上で置換されていてもよいC 3－C 8シクロアルキル基であるか、
- 25 あるいはR<sup>1</sup> および R<sup>2</sup> が、R<sup>1</sup> と R<sup>2</sup> とが結合している窒素原子と一緒にあって、
- 3－8員環の複素環基（該複素環基は、C 1－C 4アルキル基、C 1－C 4アルコキシ基、C 1－C 4アルキルチオ基、C 1－C 3ハロアルキル基、C 1－C 4アシル基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、ニトロ基、シアノ基およびC 2－C 5

アルコキシカルボニル基からなる群より選ばれる1種以上で置換されていてもよい。)である請求項1に記載のイミダゾ [1, 2-a] ピリミジン。

7. 式 [I] において、

- 5  $R^1$  および  $R^2$  が独立して、C1-C4アルコキシ基、C2-C8ジアルキルアミノ基、C1-C4アルキルチオ基、C2-C5アルコキシカルボニル基、シアノ基およびハロゲン原子のうちの1種以上によって置換されていてもよいC1-C6アルキル基；ハロゲン原子によって置換されていてもよいC3-C6アルケニル基；またはハロゲン原子によって置換されていてもよいC3-C6アルキニル基；C1-C4アルキル基およびハロゲン原子のうちの1種以上で置換されてい
- 10 てもよいC3-C8シクロアルキル基であるか、

- あるいは  $R^1$  および  $R^2$  が、 $R^1$  と  $R^2$  とが結合している窒素原子と一緒にあって、3-8員環の複素環基（該複素環基は、C1-C4アルキル基、C1-C4アルコキシ基、C1-C4アルキルチオ基、C1-C3ハロアルキル基、C1-C4
- 15 アシル基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、ニトロ基、シアノ基およびC2-C5アルコキシカルボニル基からなる群より選ばれる1種以上で置換されていてもよい。)である請求項1に記載のイミダゾ [1, 2-a] ピリミジン。

8. 式 [I] において、

- 20  $R^1$  および  $R^2$  が、 $R^1$  と  $R^2$  とが結合している窒素原子と一緒にあって、3-8員環の複素環基（該複素環基は、C1-C4アルキレン基またはC2-C4アルケニレン基で置換されて多環系複素環基を表していてもよく、C1-C4アルキル基、C1-C4アルコキシ基、C1-C4アルキルチオ基、C1-C3ハロアルキル基、C1-C4アシル基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、ニトロ基、シア
- 25 ノ基およびC2-C5アルコキシカルボニル基からなる群より選ばれる1種以上で置換されていてもよい。)である請求項1に記載のイミダゾ [1, 2-a] ピリミジン。

9. 式 [I] において、

$R^1$  および  $R^2$  が、 $R^1$  と  $R^2$  とが結合している窒素原子と一緒に示す 3-8 員環の複素環基が、ピロリジン-1-イル基、ピペリジン-1-イル基、モルホリン-4-イル基、チオモルホリン-4-イル基またはヘキサメチレン-1-イル基である請求項 8 に記載のイミダゾ [1, 2-a] ピリミジン。

5

10. 式 [I] において、

A r がその 2 位、4 位および 6 位のうちの 1 箇所以上がハロゲン原子で置換されたフェニル基である請求項 1~9 のいずれかに記載のイミダゾ [1, 2-a] ピリミジン。

10

11. 式 [I] において、

A r がその 2 位、4 位および 6 位のうちの 2 箇所以上がフッ素原子または塩素原子で置換され、3 位および 5 位が置換されていないフェニル基である請求項 1~9 のいずれかに記載のイミダゾ [1, 2-a] ピリミジン。

15

12. 式 [I] において、

A r が 2, 6-ジフルオロフェニル基、2, 4, 6-トリフルオロフェニル基、4-クロロ-2, 6-ジフルオロフェニル基、2-クロロ-6-フルオロフェニル基、2-クロロ-4, 6-ジフルオロフェニル基または 2, 4-ジクロロ-6-フルオロフェニル基である請求項 1~9 のいずれかに記載のイミダゾ [1, 2-a] ピリミジン。

20

13. 式 [I] において、

$R^3$  が塩素原子またはメチル基であり、A r が 2, 6-ジフルオロフェニル基、2, 4, 6-トリフルオロフェニル基、4-クロロ-2, 6-ジフルオロフェニル基、2-クロロ-6-フルオロフェニル基、2-クロロ-4, 6-ジフルオロフェニル基または 2, 4-ジクロロ-6-フルオロフェニル基である請求項 1~9 のいずれかに記載のイミダゾ [1, 2-a] ピリミジン。

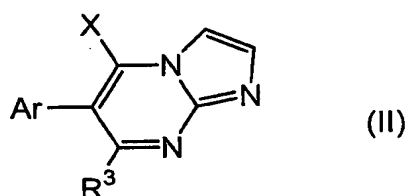
25

14. 請求項1に記載のイミダゾ[1, 2-a]ピリミジンを有効成分として含有する殺菌剤組成物。

15. 殺菌剤の有効成分としての、請求項1に記載のイミダゾ[1, 2-a]ピリミジンの使用。

16. 請求項1に記載のイミダゾ[1, 2-a]ピリミジンを、植物または植物を栽培する土壤に施用する植物病害の防除方法。

10 17. 下式 [II]



[式中、Xはハロゲン原子を表し、R<sup>3</sup> はハロゲン原子またはC1-C4アルキル基を表し、Arはハロゲン原子、C1-C4アルキル基、C1-C4アルコキシ基またはC1-C3ハロアルキル基から選ばれる群より選ばれる1種以上で置換されていてもよいフェニル基を表す。]

15 17. 請求項17に記載のイミダゾ[1, 2-a]ピリミジン。

18. 式 [II] において、Arがその2位、4位および6位のうちの1箇所以上がハロゲン原子で置換されたフェニル基である請求項17に記載のイミダゾ[1, 2-a]ピリミジン。

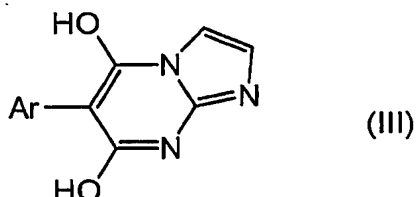
20

19. 式 [II] において、Arが2, 6-ジフルオロフェニル基、2, 4, 6-トリフルオロフェニル基、4-クロロ-2, 6-ジフルオロフェニル基、2-クロロ-6-フルオロフェニル基、2-クロロ-4, 6-ジフルオロフェニル基または2, 4-ジクロロ-6-フルオロフェニル基である請求項17に記載のイミダゾ[1, 2-a]ピリミ

25

ジン。

## 20. 下式 [III]



- 5 [式中、Arはハロゲン原子、C1-C4アルキル基、C1-C4アルコキシ基またはC1-C3ハロアルキル基から選ばれる群より選ばれる1種以上で置換されていてもよいフェニル基を表す。]

で示されるイミダゾ [1, 2-a] ピリミジン。

- 10 21. 式 [III] において、

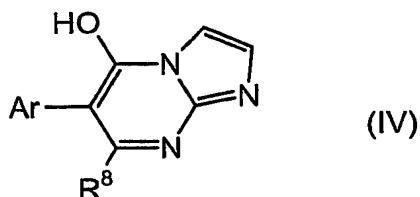
Arがその2位、4位および6位のうちの1箇所以上がハロゲン原子で置換されたフェニル基である請求項20に記載のイミダゾ [1, 2-a] ピリミジン。

22. 式 [III] において、

- 15 Arが2, 6-ジフルオロフェニル基、2, 4, 6-トリフルオロフェニル基、4-クロロ-2, 6-ジフルオロフェニル基、2-クロロ-6-フルオロフェニル基、2-クロロ-4, 6-ジフルオロフェニル基または2, 4-ジクロロ-6-フルオロフェニル基である請求項20に記載のイミダゾ [1, 2-a] ピリミジン。

20

## 23. 下式 [IV]



[式中、R<sup>8</sup> はC1-C4アルキル基を表し、Arはハロゲン原子、C1-C4

アルキル基、C 1－C 4アルコキシ基またはC 1－C 3ハロアルキル基から選ばれる群より選ばれる1種以上で置換されていてもよいフェニル基を表す。]

で示されるイミダゾ [1, 2－a] ピリミジン。

5 24. 式 [I V] において、

A r がその2位、4位および6位のうちの1箇所以上がハロゲン原子で置換されたフェニル基である請求項23に記載のイミダゾ [1, 2－a] ピリミジン。

25. 式 [I V] において、

- 10 A r が2, 6－ジフルオロフェニル基、2, 4, 6－トリフルオロフェニル基、4－クロロ－2, 6－ジフルオロフェニル基、2－クロロ－6－フルオロフェニル基、2－クロロ－4, 6－ジフルオロフェニル基または2, 4－ジクロロ－6－フルオロフェニル基である請求項23に記載のイミダゾ [1, 2－a] ピリミジン。

# INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP02/08718

## A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

Int.Cl<sup>7</sup> C07D487/04, A01N43/90

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

## B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

Int.Cl<sup>7</sup> C07D487/04, A01N43/90

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used)

CAPLUS (STN), CAOLD (STN), REGISTRY (STN), WPI/L (DIALOG)

## C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	US 3923811 A (Minnesota Mining and Manufacturing Co.), 02 December, 1975 (02.12.75), Concerning the imidazo[1,2-a]pyrimidine having an antibacteria action, see the compound of example 21 and the description such as paragraph 8. (Family: none)	1-25
A	US 5994360 A (American Cyanamid Co.), 30 November, 1999 (30.11.99), Concerning the triazolo pyrimidine compound having antibacteria and antifungal actions and the same substituent as that of the compound of the present application, see the whole description. (Family: none)	17-25

☒ Further documents are listed in the continuation of Box C.

☐ See patent family annex.

\* Special categories of cited documents:

"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance

"E" earlier document but published on or after the international filing date

"L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)

"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means

"P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

"I" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention

"X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone

"Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art

"&" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search  
19 November, 2002 (19.11.02)

Date of mailing of the international search report  
10 December, 2002 (10.12.02)

Name and mailing address of the ISA/  
Japanese Patent Office

Authorized officer

Facsimile No.

Telephone No.

**INTERNATIONAL SEARCH REPORT**

International application No.

PCT/JP02/08718

**C (Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT**

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	US 5137131 A (Takeda Chemical Industries, Ltd.), 11 August, 1992 (11.08.92), All pages & EP 404190 A1                      & JP 4-18091 A	1-25
A	JP 2001-19693 A (American Cyanamid Co.), 23 January, 2001 (23.01.01), Compounds stated in table 3 on pages 83 to 84 & FR 2794745 A	17-25

A. 発明の属する分野の分類 (国際特許分類 (IPC))  
Int. Cl<sup>7</sup> C07D487/04, A01N43/90

B. 調査を行った分野  
調査を行った最小限資料 (国際特許分類 (IPC))  
Int. Cl<sup>7</sup> C07D487/04, A01N43/90

最小限資料以外の資料で調査を行った分野に含まれるもの

国際調査で使用した電子データベース (データベースの名称、調査に使用した用語)  
CAPLUS (STN), CAOLD (STN), REGISTRY (STN), WPI/L (DIALOG)

C. 関連すると認められる文献

引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
A	US 3923811 A (MINNESOTA MINING AND MANUFACTURING COMPANY) 1975. 12. 02 抗菌作用を有するイミダゾ[1, 2-a]ピリミジン化合物に関して、Example 21 に記載の化合物、及び、第 8 欄等を参照。 (ファミリーなし)	1-25
A	US 5994360 A (AMERICAN CYANAMID COMPANY) 1999. 11. 30 抗菌・抗カビ作用を有し、本願化合物と同一の置換基を有するトリ アゾロピリミジン化合物に関して、全頁を参照。 (ファミリーなし)	17-25

☒ C 欄の続きにも文献が列挙されている。

☐ パテントファミリーに関する別紙を参照。

\* 引用文献のカテゴリー

「A」 特に関連のある文献ではなく、一般的技術水準を示すもの  
「E」 国際出願日前の出願または特許であるが、国際出願日以後に公表されたもの  
「L」 優先権主張に疑義を提起する文献又は他の文献の発行日若しくは他の特別な理由を確立するために引用する文献 (理由を付す)  
「O」 口頭による開示、使用、展示等に言及する文献  
「P」 国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願

の日の後に公表された文献

「T」 国際出願日又は優先日後に公表された文献であって出願と矛盾するものではなく、発明の原理又は理論の理解のために引用するもの  
「X」 特に関連のある文献であって、当該文献のみで発明の新規性又は進歩性がないと考えられるもの  
「Y」 特に関連のある文献であって、当該文献と他の 1 以上の文献との、当業者にとって自明である組合せによって進歩性がないと考えられるもの  
「&」 同一パテントファミリー文献

国際調査を完了した日  
19. 11. 02

国際調査報告の発送日  
10.12.02

国際調査機関の名称及びあて先  
日本国特許庁 (ISA/J P)  
郵便番号 100-8915  
東京都千代田区霞が関三丁目 4 番 3 号

特許庁審査官 (権限のある職員)  
榊原 貴子



4 P 3040

電話番号 03-3581-1101 内線 3450

C (続き) . 関連すると認められる文献		
引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
A	US 5137131 A (TAKEDA CHEMICAL INDUSTRIES, LTD.) 1992.08.11 全頁を参照。 &EP 404190 A1 &JP 4-18091 A	1-25
A	JP 2001-19693 A (AMERICAN CYANAMID COMPANY) 2001.01.23 第83～84頁 TABLE 3 に記載の化合物等を参照。 &FR 2794745 A	17-25